

[19]中华人民共和国专利局

[11] 公开号 CN 1118165A



## [12] 发明专利申请公开说明书

[21]申请号 94191272.8

[51]Int.Cl<sup>6</sup>

C07D261/12

[43]公开日 1996年3月6日

[22]申请日 94.2.12

[30]优先权

[32]93.2.23 [33]DE[31]P4305502.8

[86]国际申请 PCT/EP94/00408 94.2.12

[87]国际公布 WO94/19331 德 94.9.1

[85]进入国家阶段日期 95.8.23

[71]申请人 巴斯福股份公司

地址 联邦德国路德维希港

[72]发明人 R·科斯特根 W·格拉莫诺斯

H·班叶尔 R·多特泽

H·科尼格 K·奥博多夫

H·索特 H·维格特

G·洛瑞兹 E·安默曼

V·哈瑞尔斯

[74]专利代理机构 中国国际贸易促进委员会专利商  
标事务所

代理人 杜京英

C07D277/34 C07D231/18

C07D231/22 A01N 43/78

A01N 43/50 A01N 43/80

C07D271/10 C07D285/08

C07D249/12 C07D233/70

C07D263/38 C07D417/04

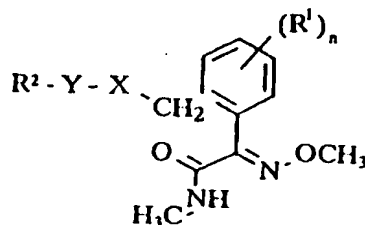
C07D413/04

权利要求书 3 页 说明书 102 页 附图页数 0 页

[54]发明名称 邻位取代的2-甲氧氨基苯基-N-甲基  
乙酰胺

[57]摘要

公开了通式 I 化合物, 其中符号和取代基的意义如下: n 和 0 或 1-4, X 为 O 或 S, Y 为五元杂芳环; R<sup>1</sup> 为硝基、氰基、卤原子、烷基、卤代烷基、烷氧基、卤代烷氧基、烷硫基、苯基或苯氧基; R<sup>2</sup> 为氢, 烷基, 链烯基或炔基, 或除碳原子还可含有杂原子作为环成员的饱和或不饱和环。



(BJ)第 1456 号

[19]中华人民共和国国家知识产权局

[51]Int. Cl<sup>6</sup>

## [12] 发明专利说明书

[21] ZL 专利号 94191272.8

C07D261/12

C07D277/34

C07D231/18. C07D231/22

A01N 43/78 A01N 43/50

A01N 43/80 C07D271/10

C07D285/08 C07D249/12

C07D233/70 C07D263/38

[11]授权公告号 CN 1046275C

[45]授权公告日 1999 年 11 月 10 日

[22]申请日 94.2.12 [24]颁证日 99.8.21

[21]申请号 94191272.8

[30]优先权

[32]93.2.23 [33]DE [31]P4305502.8

[86]国际申请 PCT/EP94/00408 94.2.12

[87]国际公布 WO94/19331 德 94.9.1

[85]进入国家阶段日期 95.8.23

[73]专利权人 巴斯福股份公司

地址 联邦德国路德维希港

[72]发明人 R·科斯特根 W·格拉莫诺斯

H·班叶尔 R·多特泽 H·科尼格

K·奥博多夫 H·索特 H·维格特

G·洛瑞兹 E·安默曼

V·哈瑞尔斯

[56]参考文献

EP0363818 1990. 4. 18 C07D21370

EP0398692 1990. 11. 22 C07D25140

EP0477631 1992. 4. 1 C07D25148

EP0513580 1992. 11. 19 C07D26120

审查员 李虹奇

[74]专利代理机构 中国国际贸易促进委员会专利商标事务所

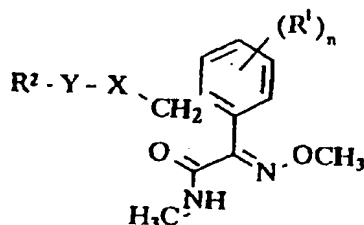
代理人 杜京英

权利要求书 3 页 说明书 103 页 附图页数 0 页

[54]发明名称 2-甲氧亚氨基苯基-N-甲基乙酰胺衍生物、其制备方法和用途及含有它的组合物

[57]摘要

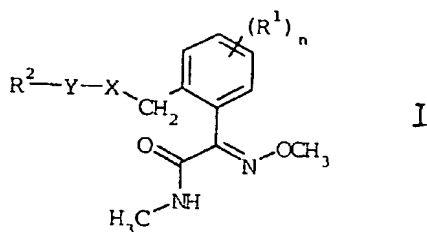
公开了通式 I 化合物,其中符号和取代基的意义如下:n 为 0 或 1—4,X 为 O 或 S;Y 为五元杂芳环;R<sup>1</sup>为硝基、氰基、卤原子、烷基、卤代烷基、烷氧基、卤代烷氧基、烷硫基、苯基或苯氧基;R<sup>2</sup>为氢、烷基、链烯基或炔基,或除碳原子还可含有杂原子作为环成员的饱和或不饱和环。



ISSN 1008-4274

# 权 利 要 求 书

## 1. 通式 I 的化合物



其中的符号和取代基的含义如下:

$n$  为 0、1、2、3、或 4, 当  $n$  大于 1 时  $R^1$  可以不同;

$X$  为 O 或 S;

$Y$  为一五元芳杂环, 除  $R^2$  外, 它还可以被  $CH_3$  或  $CF_3$  取代;

$R^1$  为卤原子、 $C_1 - C_4$  烷基或  $C_1 - C_4$  烷氧基;

$R^2$  为氢、乙酰基、氰基,

可被一个或多个卤原子或  $C_1 - C_6$  烷氧亚氨基取代的  $C_1 - C_6$  烷基,

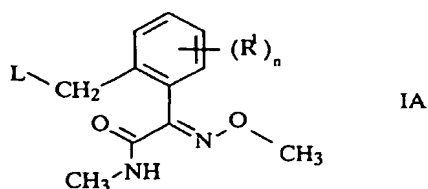
环丙基、环戊基、四氢呋喃基、四氢噻吩基、1, 3 - 二氧戊环基、1, 3 - 二噻烷基、四氢吡喃基,

苯基、吡啶基或含有 1 - 3 个氮原子和/或一个氧或硫原子的五元芳杂环, 这些基团可带有一个或多个下列取代基:

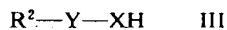
卤原子、氰基、 $C_1 - C_6$  烷基、 $C_1 - C_4$  卤代烷基、 $C_1 - C_4$  烷氧基、硝基、氰硫基、 $C_1 - C_4$  卤代烷氧基、 $C_2 - C_6$  链烯基和苯基。

98 07 31

2. 权利要求1所要求的通式I化合物的制备方法,它包括式IA的2-甲氧亚氨基苯乙酸衍生物

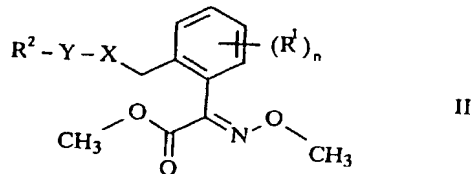


其中  $R^1$  同权利要求1中所定义, L 为离去基团,  
在碱存在下与通式 III 的羟基—或巯基取代的五元杂环反应,



其中  $R^2$ 、Y 和 X 同权利要求1中所定义。

3. 如权利要求1所要求的通式I化合物的制备方法,其包括式II的2-甲氧亚氨基苯乙酸衍生物与甲基胺反应:



其中  $R^1$ 、 $R^2$ 、Y、X 和 n 同权利要求1中所定义。

4. 控制有害真菌的组合物,其含有杀真菌有效量的如权利要求1中所要求的式I化合物和惰性添加剂。

5. 一种杀虫剂,其含有有效量的如权利要求1所要求的式I化合物和惰性添加剂。

6. 一种控制有害真菌的方法,其包括用杀真菌有效量的权利要求1要求的式I化合物,处理有害真菌、它们的环境或希望消除有害真菌的植物或材料。

98 07 31

7. 一种控制害虫的方法, 其包括用在有效量的权利要求 1 所要求的式 I 化合物处理害虫、它们的环境或希望消除害虫的植物或材料。

8. 如权利要求 1 所要求的化合物 I 控制有害真菌的用途。

9. 如权利要求 1 所要求的化合物 I 控制昆虫、蛛形虫和线虫类害虫的用途。

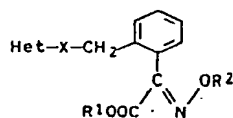
98 07 31

## 说 明 书

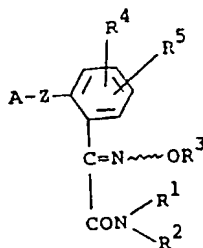
2 - 甲氧亚氨基苯基 - N - 甲基乙酰胺衍生物、  
其制备方法和用途及含有它的组合物

本发明涉及 2 - 甲氧亚氨基苯基乙酰胺衍生物，特别是邻位取代的二甲氧亚氨基苯基 - N - 甲基乙酰胺化合物，它们的制备方法和抗真菌及虫害的用途及含有它们的组合物。

欧洲专利申请 EP - A 0363818 中公开了 下式的抗真菌活性脒醚衍生物：

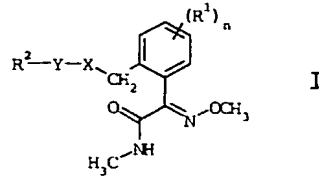


欧洲专利申请 EP - A 0398692 中公开了下式烷氧亚氨基乙酰胺衍生物和它们作为杀真菌剂的应用。



98 07 31

本发明涉及通式 I 的化合物:



其中的符号和取代基的含义如下:

$n$  为 0、1、2、3 或 4, 如果  $n$  大于 1,  $R^1$  基团可能不同;

$X$  为 O 或 S;

$Y$  为五元杂芳环, 除  $R^2$  外, 它还可以带有一到两个选自  $Cl$ 、 $CH_3$ 、 $CF_3$  和  $OCH_3$  的基团;

$R^1$  为硝基; 氰基; 卤原子;

$C_{1-4}$ 烷基;  $C_{1-4}$ 卤代烷基;  $C_{1-4}$ 烷氧基;  $C_{1-4}$ 卤代烷氧基;  $C_{1-4}$ 烷硫基;

苯基或苯氧基, 这种芳环可能带有 1—5 个卤原子或 1—3 个下列基团: 卤原子、 $C_{1-4}$ 烷基、 $C_{1-4}$ 卤代烷基、 $C_{1-4}$ 烷氧基、 $C_{1-4}$ 卤代烷氧基和  $C_{1-4}$ 烷硫基;

或, 当  $n$  大于 1 时, 与苯基的两个相邻碳原子键合的 1, 3-丁二烯-1, 4-二基, 其本身可带有 1-4 个卤原子或 1-2 个下列基团: 硝基、氰基、卤原子、 $C_{1-4}$  卤代烷基、 $C_{1-4}$  烷氧基、 $C_{1-4}$  卤代烷氧基和  $C_{1-4}$  烷硫基;

$R^2$  为氢;

取代或未取代的烷基、链烯基或炔基;

取代或未取代的, 饱和或一不饱和或二不饱和环, 除碳原子外, 它可含有 1-3 个下列杂原子作为环成员: 氧、硫和氮;

取代或未取代的, 单核或双核芳环, 除碳原子外, 它可含有 1-4 个氮原子或一个或两个氮原子和氧或硫原子或氧或硫原子作为环成员。

本发明还涉及制备这些化合物的方法, 含有它们的组合物和它们控制真菌和害虫的用途。

取代的 2-烷氧亚氨基苯基乙酰胺是已知的 (EP-A 398 692, EP-A-477 631, JP-A 4 182 461, WO 92/13830 和 GB 2253 624)。这些化合物具有杀真菌作用, 部分还具有杀虫作用 (EP-A 477 631)。但它们的作用是不令人满意的。

令人惊异地发现, 本发明的通式 I 化合物的活性和植物耐受性大大改善。

另外, 发现了制备这些化合物的方法, 含有它们的组合物, 和它们用于控制真菌和害虫的用途。

用类似于文献中已知的各种方法的方法制备式 I 化合物。在化合物 I 的合成中, 从相应的前体合成  $R^2-Y-XCH_2-$  基团或  $-C(=NOCH_3)-CO-NHCH_3$  基团的顺序从总体来看是不重要的。



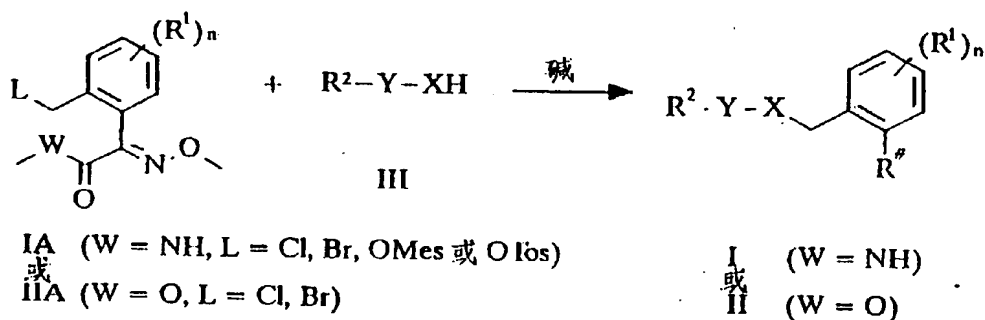
特别优选通过下述方法得到这些基团，为了更清楚，不参与反应的基团在下述反应路线中以简化方式表示：

$R^2-Y-XCH_2$ —基团或其前体用  $R^*$  表示,

—C(=NOCH<sub>3</sub>)—CO—NHCH<sub>3</sub> 或其前体用 R<sup>n</sup> 表示。

A: 合成  $R^2-Y-XCH_2-$  基团的方法

通过 IA 或 IIA 与羟基—或巯基—取代的五元环杂芳系统 III 在惰性溶剂中在碱存在下的反应，得到通式 I 和 II 的化合物。



**Mes** =  $\text{H}_3\text{CSO}_2^-$

Tos = 4-CH<sub>3</sub>-苯基 -SO<sub>2</sub>-

此反应一般在 0℃ 到 80℃，优选 20℃ 到 60℃ 下进行。

适当的溶剂为芳烃如甲苯、邻—、间—和对—二甲苯，卤代烃如二氯甲烷、氯仿和氯苯，醚如乙醚、二异丙基醚、叔丁基甲基醚、二恶烷、茴香醚和四氢呋喃，腈如乙腈和丙腈，醇如甲醇、乙醇、正

丙醇、异丙醇、正丁醇和叔丁醇，酮如丙酮和甲基乙基酮，以及二甲亚砜、二甲基甲酰胺、二甲基乙酰胺、1,3-二甲基咪唑烷-2-酮和1,3-二甲基四氢-2(1H)-嘧啶，特别优选二氯甲烷、丙酮和二甲基甲酰胺。

还可以使用这些溶剂的混合物。

适宜的碱一般为：无机化合物如碱金属和碱土金属氢氧化物，如氢氧化锂、氢氧化钠、氢氧化钾、氢氧化钙，碱金属和碱土金属氧化物，如氧化锂、氧化钠、氧化钙、和氧化镁，碱金属和碱土金属氮化物，如氮化锂、氮化钠、氮化钾和氮化钙，碱金属和碱土金属胺化物，如氨基锂、氨基钠和氨基钾，碱金属和碱土金属碳酸盐，如碳酸钾和碳酸钙，和碱金属碳酸氢盐如碳酸钾和碳酸钙和碱金属碳酸氢盐，如碳酸氢钠，有机金属化合物，特别是碱金属烷基化物，如甲基锂、丁基锂和苯基锂，烷基镁卤化物如甲基氯化镁，以及碱金属和碱土金属烷氧化物，如甲醇钠、乙醇钠、乙醇钾、叔丁醇钾和二甲基氨基镁，另外还有有机碱，如，叔胺如三甲胺、三乙胺、二异丙基乙基胺和N-甲基哌啶、吡啶、取代的吡啶如可力丁、二甲基吡啶和4-二甲氨基吡啶，以及双环胺。

特别优选氢氧化钠、氯化钠、碳酸钾和叔丁醇钾。

一般使用等摩尔量的碱，过量的碱或适当时用作溶剂。

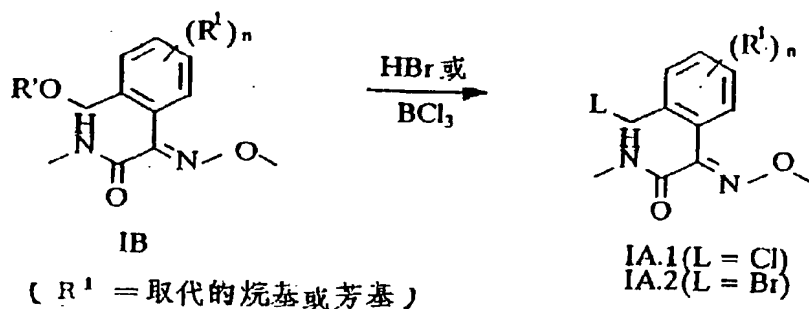
加入催化量的冠醚如18-冠-6或15-冠-5对反应有利。

此反应还可在两相系统中进行，该系统由碱金属或碱土金属氢氧化物或碱金属或碱土金属碳酸盐的水溶液和有机相如卤代烃组成。使用的相转移催化剂可为卤化铵和四氟硼酸铵，如苄基三乙基氯化铵、苄基三丁基溴化铵、四丁基氯化铵、十六烷基三甲基溴化

铵或四氟硼酸四丁基铵盐，及卤化磷如四丁基氯化磷或四苯基溴化磷。

先用碱处理化合物 III，生成的盐再与化合物 IA 或 IIA 反应对反应有利。

相应的烷氧基或芳氧基化合物 IB 用如三氯化硼 (IA. 1) 或用溴化氢 (IA. 2) 在惰性溶剂如卤代烃中于  $-30^{\circ}\text{C}$  到  $+40^{\circ}\text{C}$  裂解，制备起始化合物 IA. 1 ( $\text{L}=\text{Cl}$ ) 和 IA. 2 ( $\text{L}=\text{Br}$ )，参见，EP 477 631，表 1，No. 332 和 333。在实施例 1 到 3 中描述了从  $\text{R}' = 2\text{-甲苯基}$  (见 EP-A 477 631，表 1，No. 94) 开始的有利制备方法。



起始化合物 IIA 的制备在文献中描述过几次，参见 EP-A 363 818。

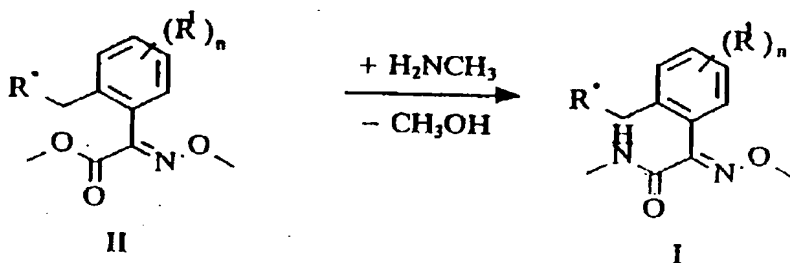
文献中描述了羟基—或巯基—五元杂环 III 的制备，或可用与其中描述的合成途径类似的方法进行制备，参见：

J. Heterocycl. Chem. **19** (1982), 541 ff; Acta Chem. Scand. **7** (1953), 374 ff; Chem. Pharm. Bull. **33** (1985), 3479 ff; Acta Chem. Scand. **17** (1963), 144ff; Canadian Patent 1 177 081;

Can J. Chem. 57 (1979), 904 ff; Ann. Chem. 338 (1905), 273 ff; German Laid-Open Application DOS 1029827; Chem. Pharm. Bull. 15 (1967), 1025 ff; Agric. Biol. Chem. 50 (1986), 1831 ff; J. Org. Chem. 23 (1958), 1021 ff; Chem. Ber. 22 (1889), 2433 ff; Chem. Ber. 24 (1891), 369 ff; J. Med. Chem. 15 (1971), 39 ff; J. Am. Chem. Soc. 76 (1954), 4450 ff.

#### B. $-\text{C}(=\text{NOCH}_3)-\text{CO}-\text{NHCH}_3$ 基团的合成方法

通过相应的 2-甲氧亚氨基苯基乙酸酯 II 氨解得到通式 I 化合物 (参见 Houben-Weyl Vol. E5, p. 983 ff)。



此反应一般在  $0^\circ\text{C}$  到  $60^\circ\text{C}$ , 优选  $10^\circ\text{C}$  到  $30^\circ\text{C}$  下进行。

以气体引入或作为水溶液向式 II 的溶液中计量供给甲基胺。

适当的溶剂为芳烃如甲苯、邻—、间—和对—二甲苯, 卤代烃如二氟甲烷、氟仿和氟苯, 醚如乙醚、二异丙基醚、叔丁基甲基醚、二恶烷、茴香醚和四氢呋喃, 及醇如甲醇、乙醇、正丙醇、异丙醇、正丁醇和叔丁醇, 特别优选甲醇、甲苯和四氢呋喃。

还可以使用上述溶剂的混合物。

关于对抗害虫特别是有害真菌、昆虫、线虫和蛛形虫的生物作用, 其中符号和取代基具有如下意义的那些式 I 化合物特别适宜:

$n$  为 0、1、2、3 或 4, 当  $n$  大于 1 时,  $R'$  基团可能不同,  $n$  特别

为 0 或 1;

X 为 O 或 S;

Y 为五元杂芳环系, 如 2-呋喃基、3-呋喃基、2-噻吩基、3-噻吩基、1-吡咯基、2-吡咯基、3-吡咯基、3-异噁唑基、4-异噁唑基、5-异噁唑基、3-异噻唑基、4-异噻唑基、5-异噻唑基、1-吡唑基、3-吡唑基、4-吡唑基、5-吡唑基、2-噁唑基、4-噁唑基、5-噁唑基、2-噻唑基、4-噻唑基、5-噻唑基、1-咪唑基、2-咪唑基、4-咪唑基、1, 2, 4-噁二唑-3-基、1, 2, 4-噁二唑-5-基、1, 2, 4-噻二唑-3-基、1, 2, 4-噻二唑-5-基、1, 2, 4-三唑-3-基、1, 2, 4-三唑-5-基、1, 3, 4-噁二唑-2-基、1, 3, 4-噻二唑-2-基、1, 2, 3-噁二唑-4-基、1, 2, 3-噁二唑-5-基、1, 2, 3-三唑-5-基和 1, 2, 3-三唑-4-基, 特别是 2-呋喃基、2-噻吩基、3-吡咯基、3-异噁唑基、5-异噁唑基、3-异噻唑基、3-吡唑基、4-吡唑基、5-吡唑基、2-噁唑基、4-噁唑基、2-噻唑基、4-噻唑基、1, 2, 4-噁二唑-5-基、1, 2, 4-噻二唑-5-基、1, 2, 4-三唑-3-基、1, 3, 4-噁二唑-2-基和 1, 3, 4-噻二唑-2-基;

R<sup>1</sup> 为硝基;

氰基;

卤原子如氟、氯、溴和碘, 特别是氟和氯;

C<sub>1-4</sub>烷基如甲基、乙基、丙基、1-甲基乙基、丁基、1-甲基丙基、2-甲基丙基和 1, 1-二甲基乙基, 优选甲基和 1-甲基乙基, 特别是甲基;

C<sub>1-4</sub>卤代烷基, 特别是 C<sub>1-2</sub>卤代烷基如三氟甲基、氟甲基、二氟

甲基、三氟甲基、氟氟甲基、二氟氟甲基、氟二氟甲基、1—氟乙基、2—氟乙基、2, 2—二氟乙基、2, 2, 2—三氟乙基、2—氟—2—氟乙基、2—氟—2, 2—二氟乙基、2, 2—二氟—2—氟乙基、2, 2, 2—三氟乙基和五氟乙基, 优选二氟甲基和三氟甲基, 特别是三氟甲基;

C<sub>1-4</sub>烷氧基如甲氧基、乙氧基、丙氧基、1—甲基乙氧基、丁氧基、1—甲基丙氧基、2—甲基丙氧基和1, 1—二甲基乙氧基, 优选甲氧基和乙氧基、1—甲基乙氧基, 特别是甲氧基;

C<sub>1-4</sub>卤代烷氧基, 特别是C<sub>1-2</sub>卤代烷氧基如二氟甲氧基、三氟甲氧基、氟甲氧基、二氟甲基氧基、三氟甲氧基、氟氟甲氧基、二氟氟甲氧基、氟二氟甲氧基、1—氟乙氧基、2—氟乙氧基、2, 2—二氟乙氧基、2, 2, 2—三氟乙氧基、2—氟—2—氟乙氧基、2—氟—2, 2—二氟乙氧基、2, 2—二氟—2—氟乙氧基、2, 2, 2—三氟乙氧基、和五氟乙氧基, 优选三氟甲氧基和氟二氟甲氧基, 特别是二氟甲氧基;

C<sub>1-4</sub>烷硫基如甲硫基、乙硫基、丙硫基、1—甲基乙硫基、丁硫基、1—甲基丙硫基、2—甲基丙硫基和1, 1—二甲基乙硫基, 优选甲硫基、乙硫基和1—甲基乙硫基, 特别是甲硫基;

苯基或苯氧基, 其中芳环可带有1—5个卤原子如氟、氯、溴和碘, 特别是氟和氯, 或1—3个下列基团:

—如上所述的卤原子;

—如上所述的C<sub>1-4</sub>烷基, 特别是甲基;

—如上所述的C<sub>1-4</sub>卤代烷基, 特别是C<sub>1-2</sub>卤代烷基, 尤其是三氟甲基;

—如上所述的C<sub>1-4</sub>烷氧基, 特别是甲氧基;

或,  $n > 1$  时, 与母核结构的两个相邻碳原子键合的 1, 3—丁二烯—1, 4—二基, 其本身可带有 1—4 个卤原子如氟、氯、溴和碘, 特别是氟和氯, 或 1—2 个下列基团;

—如上所述的卤原子,

—硝基,

—氰基,

—如上所述的  $C_{1-4}$  烷基, 特别是甲基;

——如上所述的  $C_{1-4}$  卤代烷基, 特别是  $C_{1-2}$  卤代烷基, 尤其是三氟甲基;

—如上所述的  $C_{1-4}$  烷氧基, 特别是甲氧基;

$R^2$  为取代或未取代的烷基, 特别是  $C_{1-6}$  烷基如甲基、乙基、丙基、1—甲基乙基、丁基、1—甲基丙基、2—甲基丙基、1, 1—二甲基乙基、戊基、1—甲基丁基、2—甲基丁基、3—甲基丁基、2, 2—二甲基丙基、1—乙基丙基、己基、1, 1—二甲基丙基、1, 2—二甲基丙基、1—甲基戊基、2—甲基戊基、3—甲基戊基、4—甲基戊基、1, 1—二甲基丁基、1, 2—二甲基丁基、1, 3—二甲基丁基、2, 2—二甲基丁基、2, 3—二甲基丁基、3, 3—二甲基丁基、1—乙基丁基、2—乙基丁基、1, 1, 2—三甲基丙基、1, 2, 2—三甲基丙基、1—乙基—2—甲基丙基和 1—乙基—2—甲基丙基, 优选甲基、乙基、1—甲基乙基、1—甲基丙基、1, 1—二甲基乙基、1, 1—二甲基丙基和 2, 3—二甲基丁基, 特别是甲基、1—甲基乙基和 1, 1—二甲基乙基。

取代或未取代的链烯基, 特别是  $C_{1-6}$  链烯基如乙烯基、2—丙烯基、2—丁烯基、3—丁烯基、1—甲基—2—丙烯基、2—甲基—2—丙烯基、2—戊烯基、3—戊烯基、4—戊烯基、1—甲基—2—丁烯基、

2—甲基—2—丁烯基、3—甲基—2—丁烯基、1—甲基—3—丁烯基、2—甲基—3—丁烯基、3—甲基—3—丁烯基、1, 1—二甲基—2—丙烯基、1, 2—二甲基—2—丙烯基、1—乙基—2—丙烯基、2—己烯基、3—己烯基、4—己烯基、5—己烯基、1—甲基—2—戊烯基、2—甲基—2—戊烯基、3—甲基—2—戊烯基、4—甲基—2—戊烯基、1—甲基—3—戊烯基、2—甲基—3—戊烯基、3—甲基—3—戊烯基、4—甲基—3—戊烯基、1—甲基—4—戊烯基、2—甲基—4—戊烯基、3—甲基—4—戊烯基、4—甲基—4—戊烯基、1, 1—二甲基—2—丁烯基、1, 1—二甲基—3—丁烯基、1, 2—二甲基—2—丁烯基、1, 2—二甲基—3—丁烯基、1, 3—二甲基—2—丁烯基、1, 3—二甲基—3—丁烯基、2, 2—二甲基—3—丁烯基、2, 3—二甲基—2—丁烯基、2, 3—二甲基—3—丁烯基、3, 3—二甲基—3—丁烯基、1—乙基—2—丁烯基、1—乙基—3—丁烯基、2—乙基—2—丁烯基、2—乙基—3—丁烯基、1, 1, 2—三甲基—2—丙烯基、1—乙基—1—甲基—2—丙烯基和1—乙基—2—甲基—2—丙烯基, 优选1—丙烯基、1—甲基—2—丙烯基、1, 1—二甲基—2—丙烯基、1, 1—二甲基—2—丁烯基, 特别是2—丙烯基和1, 1—二甲基—2—丙烯基;

或取代或未取代的炔基, 特别是 $C_{3-6}$ 炔基如2—丙炔基、2—丁炔基、3—丁炔基、1—甲基—2—丙炔基、2—戊炔基、3—戊炔基、4—戊炔基、1, 1—甲基—2—丁炔基、1—甲基—3—丁炔基、2—甲基—3—丁炔基、1, 1—二甲基—2—丙炔基、1—乙基—2—丙炔基、2—己炔基、3—己炔基、4—己炔基、5—己炔基、1—甲基—2—戊炔基、1—甲基—3—戊炔基、1—甲基—4—戊炔基、2—甲基—3—戊炔基、2—甲基—4—戊炔基、3—甲基—4—戊炔基、4—甲基—2—



戊炔基、1, 1—二甲基—2—丁炔基、1, 1—二甲基—3—丁炔基、1, 2—二甲基—3—丁炔基、2, 2—二甲基—3—丁炔基、3, 3—二甲基—1—丁炔基、1—乙基—2—丁炔基、1—乙基—3—丁炔基、2—乙基—3—丁炔基和1—乙基—1—甲基—2—丙炔基, 优选2—丙炔基、1—甲基—2—丙炔基、1—甲基—2—丁炔基、1, 1—二甲基—2—丙炔基和1, 1—二甲基—2—丁炔基, 特别是2—丙炔基、1—甲基—2—丙炔基和1, 1—二甲基—2—丙炔基;

取代或未取代的, 饱和或一不饱和或二不饱和环, 除碳原子外, 它还可以含有1—3个下列杂原子作为环成员: 氧、硫和氮, 例如碳环如环丙基、环戊基、环己基、环戊—2—烯基、环己—2—烯基, 含有1—3个氮原子和/或氧原子或硫原子的5—6元饱和或不饱和杂环, 如2—四氢呋喃基、3—四氢呋喃基、2—四氢噻吩基、3—四氢噻吩基、2—吡啶烷基、3—吡咯烷基、3—异噁唑烷基、4—异噁唑烷基、5—异噁唑烷基、3—异噻唑烷基、4—异噻唑烷基、5—异噻唑烷基、3—吡唑烷基、4—吡唑烷基、4—吡唑烷基、5—吡唑烷基、2—噁唑烷基、4—噁唑烷基、5—噁唑烷基、2—噻唑烷基、4—噻唑烷基、5—噻唑烷基、2—咪唑烷基、4—咪唑烷基、1, 2, 4—噁二唑烷—3—基、1, 2, 4—噁二唑烷—5—基、1, 2, 4—噻二唑烷—3—基、1, 2, 4—噻二唑烷—5—基、1, 2, 4—三唑烷—3—基、1, 3, 4—噁二唑烷—2—基、1, 3, 4—噻二唑烷—2—基、1, 3, 4—三唑烷—2—基、2, 3—二氢呋喃—2—基、2, 3—二氢呋喃—3—基、2, 4—二氢呋喃—2—基、2, 4—二氢呋喃—3—基、2, 3—二氢噻吩—2—基、2, 3—二氢噻吩—3—基、2, 4—二氢噻吩—2—基、2, 4—二氢噻吩—3—基、2, 3—吡咯啉—2—基、2, 3—吡咯啉—3—

基、2, 4—吡咯啉—2—基、2, 4—吡咯啉—3—基、2, 3—异噁唑啉—3—基、3, 4—异噁唑啉—3—基、4, 5—异噁唑啉—3—基、2, 3—异噁唑啉—4—基、3, 4—异噁唑啉—4—基、4, 5—异噁唑啉—4—基、2, 3—异噁唑啉—5—基、3, 4—异噁唑啉—5—基、4, 5—异噁唑啉—5—基、2, 3—异噻唑啉—3—基、3, 4—异噻唑啉—3—基、4, 5—异噻唑啉—3—基、2, 3—异噻唑啉—4—基、3, 4—异噻唑啉—4—基、4, 5—异噻唑啉—4—基、2, 3—异噻唑啉—5—基、3, 4—异噻唑啉—5—基、4, 5—异噻唑啉—5—基、2, 3—二氮吡唑—1—基、2, 3—二氮吡唑—2—基、2, 3—二氮吡唑—3—基、2, 3—二氮吡唑—4—基、2, 3—二氮吡唑—5—基、3, 4—二氮吡唑—1—基、3, 4—二氮吡唑—3—基、3, 4—二氮吡唑—4—基、3, 4—二氮吡唑—5—基、4, 5—二氮吡唑—1—基、4, 5—二氮吡唑—3—基、4, 5—二氮吡唑—4—基、4, 5—二氮吡唑—5—基、2, 3—二氮噁唑—2—基、2, 3—二氮噁唑—3—基、2, 3—二氮噁唑—4—基、2, 3—二氮噁唑—5—基、3, 4—二氮噁唑—2—基、3, 4—二氮噁唑—3—基、3, 4—二氮噁唑—4—基、3, 4—二氮噁唑—5—基、3, 4—二氮噁唑—2—基、3, 4—二氮噁唑—3—基、3, 4—二氮噁唑—4—基、2—哌啶基、3—哌啶基、4—哌啶基、1, 3—二噁烷—5—基、2—四氢吡喃基、4—四氢吡喃基、2—四氢噻吩基、3—四氢哒嗪基、4—四氢哒嗪基、2—四氢嘧啶基、4—四氢嘧啶基、5—四氢嘧啶基、2—四氢吡嗪基、1, 3, 5—四氢三嗪—2—基和1, 2, 4—四氢三嗪—3—基, 优选2—四氢呋喃基、2—四氢噻吩基、2—吡咯烷基、3—异噁唑烷基、3—异噻唑烷基、1, 3, 4—噁唑烷—2—基、2, 3—二氮噻吩—2—基、4, 5—异噁唑啉—3—基、3—哌啶基、1, 3—二噁烷—

5—基、4—吡啶基、2—四氢吡喃基、4—四氢吡喃基；

或取代或未取代的单核或双核芳环系统，除碳原子外，它可含有1—4个氮原子或1—2个氮原子和氧或硫原子或氧或硫原子作为环成员，即芳基如苯基和萘基，优选苯基或1—或2—萘基，及杂芳基，例如含1—3个氮原子和/或氧原子或硫原子的5元杂芳环，如2—咪唑基、3—咪唑基、2—噻吩基、3—噻吩基、1—吡咯基、2—吡咯基、3—吡咯基、3—异噁唑基、4—异噁唑基、5—异噁唑基、3—异噻唑基、4—异噻唑基、5—异噻唑基、1—吡唑基、3—吡唑基、4—吡唑基、5—吡唑基、2—噁唑基、4—噁唑基、5—噁唑基、2—噻唑基、4—噻唑基、5—噻唑基、1—咪唑基、2—咪唑基、4—咪唑基、1, 2, 4—噁二噻—3—基、1, 2, 4—噁二唑—5—基、1, 2, 4—噻二唑—3—基、1, 2, 4—噻二唑—5—基、1, 2, 5—三唑—3—基、1, 2, 3—三唑—4—基、1, 2, 3—三唑—5—基、1, 2, 3—三唑—4—基、5—四唑基、1, 2, 3, 4—噻三唑—5—基和1, 2, 3, 4—噁三唑—5—基，特别是3—噁唑基、5—噁唑基、4—噁唑基、4—噻唑基、1, 3, 4—噁二唑—2—基和1, 3, 4—噻二唑—2—基；

含有1—4个氮原子作为杂合原子的六元杂芳环，如2—吡啶基、3—吡啶基、4—吡啶基、3—哒嗪基、4—哒嗪基、2—嘧啶基、4—嘧啶基、5—嘧啶基、2—吡嗪基、1, 3, 5—三嗪—2—基、1, 2, 4—三嗪—3—基和1, 2, 4, 5—四嗪—3—基，特别是2—吡啶基、3—吡啶基、4—吡啶基、2—嘧啶基、4—嘧啶基、2—吡嗪基和4—哒嗪基。

以上提及的单核或双核芳系或杂芳系其本身被部分卤代或完全卤代，即这些基团的氮原子可部分或全部被卤原子取代，如氟、氯、

溴和碘，优选氟和氯。

除指明的卤原子外，这些单核或双核芳系或杂芳系还可带有1—3个下列取代基：

硝基；

氰基，氰硫基；

烷基，特别是如上述及的 $C_{1-6}$ 烷基，优选甲基、乙基、1—甲基乙基、1, 1—二甲基乙基、丁基、己基，特别是甲基和1—甲基乙基；

链烯基，特别是如上述及的 $C_{2-6}$ 链烯基，优选乙烯基、1—丙烯基、2—丙烯基、1—甲基—2—丙烯基、2—丁烯基、3—丁烯基、3—己烯基，特别是乙烯基，2—丙烯基和2—丁烯基；

炔基，特别是如上述及的 $C_{2-6}$ 炔基，优选乙炔基、2—丙炔基、1—甲基—2—丁炔基、1—二甲基—2—丁炔基，特别是乙炔基和1, 1—二甲基—2—丁炔基；

如上述及的 $C_{1-4}$ 卤代烷基，优选三氟甲基、二氟甲基、三氟甲基、2, 2—二氟乙基、2, 2, 2—三氟乙基和五氟乙基；

$C_{1-4}$ 烷氧基，优选甲氧基、乙氧基、1—甲基乙氧基和1, 1—二甲基乙氧基，特别是甲氧基；

$C_{1-4}$ 卤代烷氧基，特别是 $C_{1-2}$ 卤代烷氧基，优选二氟甲氧基、三氟甲氧基和2, 2, 2—三氟乙氧基，特别是二氟甲氧基；

$C_{1-4}$ 烷硫基，优选甲硫基和1—甲基乙硫基，特别是甲硫基；

$C_{1-4}$ 烷基氨基如甲氨基、乙氨基、丙氨基、1—甲基乙氨基、丁氨基、1—甲基丙氨基、2—甲基丙氨基和1, 1—二甲基乙氨基，优选甲氨基和1, 1—二甲基乙氨基，特别是甲氨基；

二— $C_{1-4}$ 烷基氨基如N, N—二甲基氨基、N, N—二乙基氨基、

N, N—二丙基氨基、N, N—二—(1—甲基乙基)氨基、N, N—二丁基氨基、N, N—二—(1—甲基丙基)氨基、N, N—二—(2—甲基丙基)氨基、N, N—二—(1, 1—二甲基乙基)氨基、N—乙基—N—甲基氨基、N—甲基—N—丙基氨基、N—甲基—N—(1—甲基乙基)氨基、N—丁基—N—甲基氨基、N—甲基—N—(1—甲基丙基)氨基、N—甲基—N—(2—甲基丙基)氨基、N—(1, 1—二甲基乙基)—N—甲基氨基、N—乙基—N—丙基氨基、N—乙基—N—(1—甲基乙基)氨基、N—丁基—N—乙基氨基、N—乙基—N—(1—甲基丙基)氨基、N—乙基—N—(2—甲基丙基)氨基、N—乙基—N—(1, 1—二甲基乙基)氨基、N—(1—甲基乙基)—N—丙基氨基、N—丁基—N—丙基氨基、N—(1—甲基丙基)—N—丙基氨基、N—(2—甲基丙基)—N—丙基氨基、N—(1, 1—二甲基乙基)—N—丙基氨基、N—丁基—N—(1—甲基乙基)氨基、N—(1—甲基乙基)—N—(1—甲基丙基)氨基、N—(1—甲基乙基)—N—(2—甲基丙基)氨基、N—(1, 1—二甲基乙基)—N—(1—甲基乙基)氨基、N—丁基—N—(1—甲基丙基)氨基、N—丁基—N—(2—甲基丙基)氨基、N—丁基—N—(1, 1—二甲基乙基)氨基、N—(1—甲基丙基)—N—(2—甲基丙基)氨基、N—(1, 1—二甲基乙基)—N—(1—甲基丙基)氨基、和 N—(1, 1—二甲基乙基)—N—(2—甲基丙基)氨基, 优选 N, N—二甲基氨基和 N, N—二乙基氨基, 特别是 N, N—二甲基氨基;

C<sub>3-6</sub>链烯基氧基如 2—丙烯氧基、2—丁烯氧基、3—丁烯氧基、1—甲基—2—丙烯氧基、2—甲基—2—丙烯氧基、2—戊烯氧基、3—戊烯氧基、4—戊烯氧基、1—甲基—2—丁烯氧基、2—甲基—2—丁

烯氧基、3—甲基—2—丁烯氧基、1—甲基—3—丁烯氧基、2—甲基—3—丁烯氧基、3—甲基—3—丁烯氧基、1, 1—二甲基—2—丙烯氧基、1, 2—二甲基—2—丙烯氧基、1—乙基—2—丙烯氧基、2—己烯氧基、3—己烯氧基、4—己烯氧基、5—己烯氧基、1—甲基—2—戊烯氧基、2—甲基—2—戊烯氧基、3—甲基—2—戊烯氧基、4—甲基—2—戊烯氧基、1—甲基—3—戊烯氧基、2—甲基—3—戊烯氧基、3—甲基—3—戊烯氧基、4—甲基—3—戊烯氧基、1—甲基—4—戊烯氧基、2—甲基—4—戊烯氧基、3—甲基—4—戊烯氧基、4—甲基—4—戊烯氧基、1, 1—二甲基—2—丁烯氧基、1, 1—二甲基—3—丁烯氧基、1, 2—二甲基—2—丁烯氧基、1, 2—二甲基—3—丁烯氧基、1, 3—二甲基—2—丁烯氧基、1, 3—二甲基—3—丁烯氧基、2, 2—二甲基—3—丁烯氧基、2, 3—二甲基—2—丁烯氧基、2, 3—二甲基—3—丁烯氧基、3, 3—二甲基—2—丁烯氧基、1—乙基—2—丁烯氧基、1—乙基—3—丁烯氧基、2—乙基—2—丁烯氧基、2—乙基—3—丁烯氧基、1, 1, 2—三甲基—2—丙烯氧基、1—乙基—1—甲基—2—丙烯氧基和1—乙基—2—甲基—2—丙烯氧基，优选2—丙烯氧基和3—甲基—2—丁烯氧基，特别是2—丙烯氧基；

C<sub>3-6</sub>炔基氧基如2—丙炔氧基、2—丁炔氧基、3—丁炔氧基、1—甲基—2—丙炔氧基、2—戊炔氧基、3—戊炔氧基、4—戊炔氧基、1—甲基—2—丁炔氧基、1—甲基—3—丁炔氧基、2—甲基—3—丁炔氧基、1, 1—二甲基—2—丙炔氧基、1—乙基—2—丙炔氧基、2—炔氧基、3—己炔氧基、4—己炔氧基、5—己炔氧基、1—甲基—2—戊炔氧基、1—甲基—3—戊炔氧基、1—甲基—4—戊炔氧基、2—甲基—3—戊炔氧基、2—甲基—4—戊炔氧基、3—甲基—4—戊炔

氧基、4—甲基—2—戊炔氧基、1,1—二甲基—2—丁炔氧基、1,1—二甲基—3—丁炔氧基、1,2—二甲基—3—丁炔氧基、2,2—二甲基—3—丁炔氧基、1—乙基—2—丁炔氧基、1—乙基—3—丁炔氧基、2—乙基—3—丁炔氧基和1—乙基—1—甲基—2—丙炔氧基,优选2—丙炔氧基和2—丁炔氧基,特别是2—丙炔氧基;

C<sub>1-6</sub>烷基羰基如甲基羰基、乙基羰基、丙基羰基、1—甲基乙基羰基、丁基羰基、1—甲基丙基羰基、2—甲基丙基羰基、1,1—二甲基乙基羰基、戊基羰基、1—甲基丁基羰基、2—甲基丁基羰基、3—甲基丁基羰基、1,1—二甲基丙基羰基、1,2—二甲基丙基羰基、2,2—二甲基丙基羰基、1—乙基丙基羰基、己基羰基、1—甲基戊基羰基、2—甲基戊基羰基、3—甲基戊基羰基、4—甲基戊基羰基、1,1—二甲基丁基羰基、1,2—二甲基丁基羰基、1,3—二甲基丁基羰基、2,2—二甲基丁基羰基、2,3—二甲基丁基羰基、3,3—二甲基丁基羰基、1—乙基丁基羰基、2—乙基丁基羰基、1,1,2—三甲基丙基羰基、1,2,2—三甲基丙基羰基、1—乙基—1—甲基丙基羰基和1—乙基—2—甲基丙基羰基,优选甲基羰基、乙基羰基和1,1—二甲基羰基,特别是乙基羰基;

C<sub>1-6</sub>烷氧羰基如甲氧羰基、乙氧羰基、丙氧羰基、1—甲基乙氧羰基、丁氧羰基、1—甲基丙氧羰基、2—甲基丙氧羰基、1,1—二甲基乙氧羰基、戊氧羰基、1—甲基丁氧羰基、2—甲基丁氧羰基、3—甲基丁氧羰基、2,2—二甲基丙氧羰基、1—乙基丙氧羰基、己氧羰基、1,1—二甲基丙氧羰基、1,2—二甲基丙氧羰基、1—甲基戊氧羰基、2—甲基戊氧羰基、3—甲基戊氧羰基、4—甲基戊氧羰基、1,1—二甲基丁氧羰基、1,2—二甲基丁氧羰基、1,3—二甲基丁氧羰基

基、2, 2—二甲基丁氧羰基、2, 3—二甲基丁氧羰基、3, 3—二甲基丁氧羰基、1—乙基丁氧羰基、2—乙基丁氧羰基、1, 1, 2—三甲基丙氧羰基、1, 2, 2—三甲基丙氧羰基、1—乙基—1—甲基丙氧羰基和1—乙基—2—甲基丙氧羰基, 优选甲氧羰基、乙氧羰基和1, 1—二甲基乙氧羰基, 特别是乙氧羰基;

C<sub>1-6</sub>烷硫基羰基如甲硫基羰基、乙硫基羰基、丙硫基羰基、1—甲基乙硫基羰基、丁硫基羰基、1—甲基丙硫基羰基、2—甲基丙硫基羰基、1, 1—二甲基乙硫基羰基、戊硫基羰基、1—甲基丁硫基羰基、2—甲基丁硫基羰基、3—甲基丁硫基羰基、2, 2—二甲基丙硫基羰基、1—乙基丙硫基羰基、己硫基羰基、1, 1—二甲基丙硫基羰基、1, 2—二甲基丙硫基羰基、1—甲基戊硫基羰基、2—甲基戊硫基羰基、3—甲基戊硫基羰基、4—甲基戊硫基羰基、1, 1—二甲基丁硫基羰基、1, 2—二甲基丁硫基羰基、1, 3—二甲基丁硫基羰基、2, 2—二甲基丁硫基羰基、2, 3—二甲基丁硫基羰基、3, 3—二甲基丁硫基羰基、1—乙基丁硫基羰基、2—乙基丁硫基羰基、1, 1, 2—三甲基丙硫基羰基、1, 2, 2—三甲基丙硫基羰基、1—乙基—1—甲基丙硫基羰基和1—乙基—2—甲基丙硫基羰基, 优选甲硫基羰基和1—甲基乙硫基羰基, 特别是甲硫基羰基;

C<sub>1-6</sub>烷基氨基羰基如甲基氨基羰基、乙基氨基羰基、丙基氨基羰基、1—甲基乙基氨基羰基、丁基氨基羰基、1—甲基丙基氨基羰基、2—甲基丙基氨基羰基、1, 1—二甲基乙基氨基羰基、戊基氨基羰基、1—甲基丁基氨基羰基、2—甲基丁基氨基羰基、3—甲基丁基氨基羰基、2, 2—二甲基丙基氨基羰基、1—乙基丙基氨基羰基、己基氨基羰基、1, 1—二甲基丙基氨基羰基、1, 2—二甲基丙基氨基羰基、1—



甲基戊基氨基羰基、2—甲基戊基氨基羰基、3—甲基戊基氨基羰基、4—甲基戊基氨基羰基、1, 1—二甲基丁基氨基羰基、1, 2—二甲基丁基氨基羰基、1, 3—二甲基丁基氨基羰基、2, 2—二甲基丁基氨基羰基、2, 3—二甲基丁基氨基羰基、3, 3—二甲基丁基氨基羰基、1—乙基丁基氨基羰基、2—乙基丁基氨基羰基、1, 1, 2—三甲基丙基氨基羰基、1, 2, 2—三甲基丙基氨基羰基、1—乙基—1—甲基丙基氨基羰基和1—乙基—2—甲基丙基氨基羰基, 优选甲基氨基羰基和乙基氨基羰基, 特别是甲基氨基羰基;

二— $C_1$ — $C_6$ 烷基氨基羰基, 特别是二— $C_1$ — $C_4$ 烷基氨基羰基如 N, N—二甲基氨基羰基、N, N—二乙基氨基羰基、N, N—二丙基氨基羰基、N, N—二—(1—甲基乙基)氨基羰基、N, N—二丁基氨基羰基、N, N—二—(1—甲基丙基)氨基羰基、N, N—二—(2—甲基丙基)氨基羰基、N, N—二—(1, 1—二甲基乙基)氨基羰基、N—乙基—N—甲基氨基羰基、N—甲基—N—丙基氨基羰基、N—甲基—N—(1—甲基乙基)氨基羰基、N—丁基—N—甲基氨基羰基、N—甲基—N—(1—甲基丙基)氨基羰基、N—甲基—N—(2—甲基丙基)氨基羰基、N—(1, 1—二甲基乙基)—N—甲基氨基羰基、N—乙基—N—丙基氨基羰基、N—乙基—N—(1—甲基乙基)氨基羰基、N—丁基—N—乙基氨基羰基、N—乙基—N—(1—甲基丙基)氨基羰基、N—乙基—N—(2—甲基丙基)氨基羰基、N—乙基—N—(1, 1—二甲基乙基)氨基羰基、N—(1—甲基乙基)—N—丙基氨基羰基、N—丁基—N—丙基氨基羰基、N—(1—甲基丙基)—N—丙基氨基羰基、N—(2—甲基丙基)—N—丙基氨基羰基、N—(1, 1—二甲基乙基)—N—丙基氨基羰基、N—丁基—N—(1—甲基乙

基) 氨基羰基、N—(1—甲基乙基)—N—(1—甲基丙基) 氨基羰基、N—(1—甲基乙基)—N—(2—甲基丙基) 氨基羰基、N—(1, 1—二甲基乙基)—N—(1—甲基乙基) 氨基羰基、N—丁基—N—(1—甲基丙基) 氨基羰基、N—丁基—N—(2—甲基丙基) 氨基羰基、N—丁基—N—(1, 1—二甲基乙基) 氨基羰基、N—(1—甲基丙基)—N—(2—甲基丙基) 氨基羰基、N—(1, 1—二甲基乙基)—N—(1—甲基丙基) 氨基羰基、和 N—(1, 1—二甲基乙基)—N—(2—甲基丙基) 氨基羰基、优选 N, N—二甲基氨基羰基和 N, N—二乙基氨基羰基, 特别是 N, N—二甲基氨基羰基;

C<sub>1-6</sub>烷基羰氧基如甲基羰氧基、乙基羰氧基、丙基羰氧基、1—甲基乙基羰氧基、丁基羰氧基、1—甲基丙基羰氧基、2—甲基丙基羰氧基、1, 1—二甲基乙基羰氧基、戊基羰氧基、1—甲基丁基羰氧基、2—甲基丁基羰氧基、3—甲基丁基羰氧基、2, 2—二甲基丙基羰氧基、1—乙基丙基羰氧基、己基羰氧基、1, 1—二甲基丙基羰氧基、1, 2—二甲基丙基羰氧基、1—甲基戊基羰氧基、2—甲基戊基羰氧基、3—甲基戊基羰氧基、4—甲基戊基羰氧基、1, 1—二甲基丁基羰氧基、1, 2—二甲基丁基羰氧基、1, 3—二甲基丁基羰氧基、2, 2—二甲基丁基羰氧基、2, 3—二甲基丁基羰氧基、3, 3—二甲基丁基羰氧基、1—乙基丁基羰氧基、2—乙基丁基羰氧基、1, 1, 2—三甲基丙基羰氧基、1, 2, 2—三甲基丙基羰氧基、1—乙基—1—甲基丙基羰氧基和 1—乙基—2—甲基丙基羰氧基, 优选甲基羰氧基、乙基羰氧基和 1, 1—二甲基乙基羰氧基, 特别是甲基羰氧基和 1, 1—二甲基乙基羰氧基;

C<sub>1-6</sub>烷基羰基氨基如甲基羰基氨基、乙基羰基氨基、丙基羰基氨基

基、1—甲基乙基羰基氨基、丁基羰基氨基、1—甲基丙基羰基氨基、2—甲基丙基羰基氨基、1,1—二甲基乙基羰基氨基、戊基羰基氨基、1—甲基丁基羰基氨基、2—甲基丁基羰基氨基、3—甲基丁基羰基氨基、2,2—二甲基丙基羰基氨基、1—乙基丙基羰基氨基、己基羰基氨基、1,1—二甲基丙基羰基氨基、1,2—二甲基丙基羰基氨基、1—甲基戊基羰基氨基、2—甲基戊基羰基氨基、3—甲基戊基羰基氨基、4—甲基戊基羰基氨基、1,1—二甲基丁基羰基氨基、1,2—二甲基丁基羰基氨基、1,3—二甲基丁基羰基氨基、2,2—二甲基丁基羰基氨基、2,3—二甲基丁基羰基氨基、3,3—二甲基丁基羰基氨基、1—乙基丁基羰基氨基、2—乙基丁基羰基氨基、1,1,2—三甲基丙基羰基氨基、1,2,2—三甲基丙基羰基氨基、1—乙基—1—甲基丙基羰基氨基和1—乙基—2—甲基丙基羰基氨基,优选甲基羰基氨基和乙基羰基氨基,特别是乙基羰基氨基;

C<sub>3-7</sub>环烷基如环丙基、环丁基、环戊基、环己基和环庚基,优选环丙基、环戊基和环己基,特别是环丙基;

C<sub>3-7</sub>环烷基氧基如环丙基氧基、环丁基氧基、环戊基氧基、环己基氧基和环庚基氧基,优选环戊基氧基和环己基氧基,特别是环己基氧基;

C<sub>3-7</sub>环烷基硫基如环丙基硫基、环丁基硫基、环戊基硫基、环己基硫基和环庚基硫基,优选环己基硫基;

C<sub>3-7</sub>环烷基氨基如环丙基氨基、环丁基氨基、环戊基氨基、环己基氨基和环庚基氨基,优选环丙基氨基和环己基氨基,特别是环丙基氨基;

C<sub>5-7</sub>环烯基如环戊烯—1—基、环戊烯—2—基、环戊烯—3—基、

环己烯—1—基、环己烯—2—基、环己烯—3—基、环庚烯—1—基、环庚烯—2—基、环庚烯—3—基和环庚烯—4—基,优选环戊烯—1—基、环戊烯—3—基和环己烯—2—基,特别是环戊烯—1—基;

如上述及的,含有1—3个氮原子和/或氧或硫原子的5—6元饱和或不饱和杂环,优选四氢吡嗪—1—基和2—四氢呋喃基、四氢吡喃—4—基和1,3—二恶烷—2—基;

苯基;

如上所述的,含1—3个氮原子和/或氧或硫原子的5元杂芳环,优选3—呋喃基、3—噻吩基、5—异恶唑基、3—异恶唑基、4—恶唑基、1,3,4—噻二唑—3—基和2—噻吩基,

上述5元杂芳环可能与苯环稠合;

含有1—3个氮原子作为杂原子的6—元杂芳基,优选5—噻啉基和3—吡啉基,上述芳环或杂芳环可能带有1—3个下列基团:氟、氯、氰基、甲基、甲氧基、三氟甲基和三氟甲氧基。

两个相邻的 $R^2$ 基团可表示可被氟取代或不取代的氧— $C_{1-2}$ —亚烷基氧基链,如—O—CH<sub>2</sub>—O—、—O—CF<sub>2</sub>—O—、—O—CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>—O—或—OCF<sub>2</sub>CF<sub>2</sub>—O—;或为 $C_{3-4}$ 亚烷基链,如亚丙基或亚丁基。

$R^2$ 基团下提及的烷基、链烯基和炔基其自身可被部分或完全卤化,即这些基团的氢原子可部分或全部被卤原子取代,如氟、氯、溴和碘,优选氟和氯。

除指出的卤原子外,所述烷基、链烯基和炔基还可以带有1—3个下列取代基:

硝基;

肟基；肟硫基；

$C_{1-4}$ 烷氧基，优选甲氧基、乙氧基和1—甲基乙氧基，特别是甲氧基；

$C_{1-4}$ 卤代烷氧基，特别是 $C_{1-2}$ 卤代烷氧基，特别是二氟甲氧基；

$C_{1-4}$ 烷硫基，优选甲硫基和1，1—二甲基乙硫基，特别是甲硫基；

$C_{1-4}$ 烷基氨基；

二— $C_{1-4}$ 烷基氨基；

$C_{3-6}$ 链烯基氧基，特别是2—丙烯氧基；

$C_{3-6}$ 炔基氧基，特别是2—丙炔氧基；

$C_{1-6}$ 烷基羰基；

$C_{1-6}$ 烷氧亚氨基(烷基—O—N=)如甲氧亚氨基、乙氧亚氨基、丙氧亚氨基、1—甲基乙氧亚氨基、丁氧亚氨基、1—甲基丙氧亚氨基、2—甲基丙氧亚氨基、1，1—二甲基乙氧亚氨基、戊氧亚氨基、1—甲基丁氧亚氨基、2—甲基丁氧亚氨基、3—甲基丁氧亚氨基、2，2—二甲基丙氧亚氨基、1—乙基丙氧亚氨基、己氧亚氨基、1，1—二甲基丙氧亚氨基、1，2—二甲基丙氧亚氨基、1—甲基戊氧亚氨基、2—甲基戊氧亚氨基、3—甲基戊氧亚氨基、4—甲基戊氧亚氨基、1，1—二甲基丁氧亚氨基、1，2—二甲基丁氧亚氨基、1，3—二甲基丁氧亚氨基、2，2—二甲基丁氧亚氨基、2，3—二甲基丁氧亚氨基、3，3—二甲基丁氧亚氨基、1—乙基丁氧亚氨基、2—乙基丁氧亚氨基、1，1，2—三甲基丙氧亚氨基、1，2，2—三甲基丙氧亚氨基、1—乙基—1—甲基丙氧亚氨基和1—乙基—2—甲基丙氧亚氨基，优选甲氧亚氨基、乙氧亚氨基、丙氧亚氨基、1，1—二甲基乙氧亚氨基和

1—甲基乙氧亚氨基，特别是甲氧亚氨基和乙氧亚氨基；

$C_3-6$ 链烯氧基亚氨基，即如上所述的  $C_3-6$ 链烯氧基通过—N=（亚氨基）连结在结构上；

$C_3-6$ 炔氧基亚氨基，即如上所述的  $C_3-6$ 炔氧基通过—N=（亚氨基）连结在结构上；

$C_1-6$ 烷氧羰基，特别是甲氧羰基、乙氧羰基和 1, 1—二甲基乙氧羰基，特别是甲氧羰基和 1, 1—二甲基乙氧羰基；

$C_1-6$ 烷硫基羰基，特别是甲硫基羰基；

$C_1-6$ 烷基氨基羰基，特别是甲基氨基羰基；

二— $C_1-6$ 烷基氨基羰基，特别是 N, N—二甲氨基羰基；

$C_1-6$ 烷基羰氧基，优选甲基羰氧基和 1, 1—二甲基乙基羰氧基，特别是甲基羰氧基；

$C_1-6$ 烷基羰基氨基，优选甲基羰基氨基和 1, 1—二甲基乙基羰基氨基，特别是甲基羰基氨基；

$C_3-7$ 环烷基，优选环丙基、环戊基和环己基，特别是环丙基；

$C_3-7$ 环烷基氧基，特别是环己基氧基；

$C_3-7$ 环烷基硫基，特别是环己基硫基；

$C_3-7$ 环烷基氨基；

$C_5-7$ 环烯基，优选环戊—1—烯基、环戊—2—烯基和环己—2—烯基，特别是环戊—1—烯基；

含有 1—3 个氮原子和/或氧或硫原子的 5—6 无饱和或不饱和杂环，如上所述，优选四氢吡喃—4—基、2—四氢呋喃基和 1, 3—二恶烷—2—基；

芳系如苯基、1—萘基和 2—萘基；

含 1—3 个氮原子和/或氧或硫原子的 5 元杂芳环,如上所述及,优选 2—呋喃基、3—呋喃基、2—噻吩基、3—噻吩基、5—异噻唑基和 4—噻唑基,特别是 2—呋喃基和 2—噻吩基,上述五元杂芳基可能与苯环稠合;

含 1—3 个氮原子作为杂原子的六元杂芳环,如优选 2—嘧啶基、5—嘧啶基和 3—吡啶基,上述六元杂芳基可能与苯环稠合。

$R^2$  基团下提及的饱和或一饱和或二不饱和脂环或杂环系统,其本身可被部分或完全卤化,即这些基团的氢原子可部分或全部被卤原子取代,如氟、氯、溴和碘,优选氟和氯。

除指明的卤原子外,这些一不饱和或二不饱和脂环或杂环系统还可带有 1—3 个下列取代基:

硝基;

氰基;

$C_{1-6}$  烷基,优选甲基和乙基,特别是甲基;

$C_{1-4}$  卤代烷基,特别是  $C_{1-2}$  卤代烷基,特别是三氟甲基;

$C_{1-4}$  烷氧基,特别是甲氧基;

$C_{1-4}$  烷硫基;

二— $C_{1-4}$  烷基氨基;

$C_{2-6}$  链烯基,优选乙烯基、1—丙烯基、2—丙烯基和 1—甲基乙炔基,特别是乙烯基和 1—甲基乙炔基;

$C_{2-6}$  炔基,优选乙炔基、2—丙炔基、1—丁炔基,特别是乙炔基;

$C_{1-6}$  烷氧羰基,优选甲氧羰基、乙氧羰基、1—甲基乙氧羰基和 1, 1—二甲基乙氧羰基,特别是乙氧羰基;

$C_{1-6}$  烷基氨基羰基;

二— $C_{1-6}$ 烷基氨基羰基；

$C_{1-6}$ 烷基羰氧基，特别是甲基羰氧基；

$C_{1-6}$ 烷基羰基氨基，特别是甲基羰基氨基和 1, 1—二甲基羰基氨基；

$C_{3-7}$ 环烷基，优选环丙基和环己基，特别是环丙基；

芳系，特别是苯基。

另外，优选其中  $R^1$  为卤原子、 $C_{1-4}$ 烷基、 $C_{1-2}$ 卤代烷基、 $C_{1-4}$ 烷氧基、 $C_{1-2}$ 卤代烷氧基或苯基的化合物 1。

还优选其中 X 为氧的那些化合物 1。

其中 Y 为 3—异噁唑基、1—吡唑基、3—吡唑基、4—吡唑基、2—噁唑基、2—噻唑基、4—噻唑基、1, 2, 4—三唑—3—基、1, 3, 4—噁二唑—2—基、1, 2, 4—噁二唑—5—基和 1, 2, 4—噻二唑—5—基，特别是 3—吡唑基、4—噻唑基和 1, 2, 4—三唑—3—基的那些化合物 1 特别有意义。

特别优选其中  $R^2$  为取代或未取代苯基的化合物 1。苯基的适当取代基优选为卤原子、氰基、 $C_{1-4}$ 烷基、 $C_{1-4}$ 烷氧基、 $C_{1-2}$ 卤代烷基、 $C_{1-2}$ 卤代烷氧基、苯基和氧基— $C_{1-2}$ 亚烷基氧基。

还优选其中  $R^2$  为取代或未取代的五元杂芳环如噻唑基、异噁唑基、噁唑基或 1, 2, 4—噁二唑基的化合物 1。五元杂芳环的适当取代基优选为卤原子、氰基、 $C_{1-6}$ 烷基、 $C_{1-6}$ 烷氧基、 $C_{1-4}$ 卤代烷基、 $C_{1-2}$ 卤代烷氧基和苯基。

还优选其中  $R^2$  为取代或未取代的六元杂芳环如吡啶基、嘧啶基、哒嗪基或吡嗪基的那些化合物 1。六元杂芳环的适当取代基优选为卤原子、氰基、 $C_{1-4}$ 烷基、 $C_{1-4}$ 烷氧基、 $C_{1-2}$ 卤代烷基、 $C_{1-2}$ 卤代



烷氧基和苯基。

还优选其中  $R^2$  为  $C_{1-6}$  烷氧亚氨基— $C_{3-6}$  链烯氧基亚氨基—或  $C_{3-6}$  炔氧基亚氨基—取代的烷基, 如甲氧亚氨基乙基、乙氧亚氨基乙基、丙氧亚氨基乙基、异丙氧亚氨基乙基、(2—丙烯) 氧基亚氨基乙基、(2—丁烯) 氧基亚氨基乙基、(2—丙炔) 氧基亚氨基乙基、甲氧亚氨基丙基、乙氧亚氨基丙基、丙氧亚氨基丙基、(2—丙烯) 氧基亚氨基丙基或 (2—丙炔) 氧基亚氨基丙基的那些化合物 1。

另外还优选下述通式 I 化合物, 其中

$Y$  为五元杂芳环系, 它除  $R^2$  外还可带有 1—2 个选自  $Cl$ 、 $CH_3$ 、 $CF_3$  和  $OCH_3$  的基团;

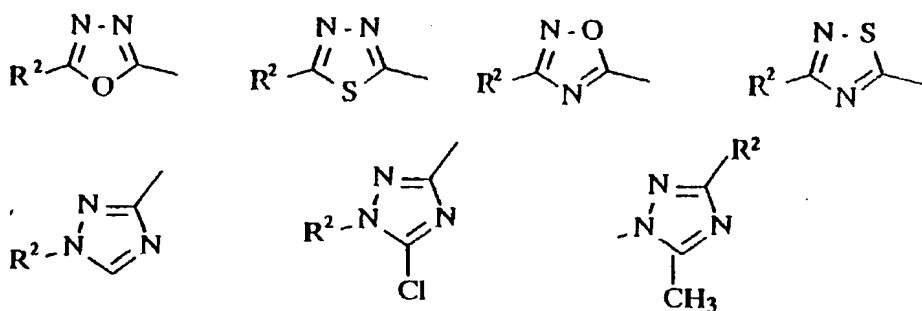
$R^1$  为卤原子、 $C_{1-4}$  烷基、 $C_{1-2}$  卤代烷基、 $C_{1-2}$  烷氧基、 $C_{1-2}$  卤代烷氧基、 $C_{1-2}$  烷硫基或苯基;

$n$  为 0 或 1;

$X$  为 O 或 S;

$R^2$  为取代或未取代的  $C_{1-4}$  烷基或取代或未取代的  $C_{3-6}$  环烷基。

另外, 还优选其中  $R^2-Y$ —为下列五元杂芳环系之一的通式 I 化合物:





另外, 优选下述通式 1 化合物, 其中

n 为 0 或 1;

X 为 O 或 S;

Y 为五元杂芳环系, 除  $R^2$  外, 它可还以带有 1—2 个选自 Cl、 $CH_3$ 、 $CF_3$  和  $OCH_3$  的基团;

$R^1$  为卤原子、 $C_{1-4}$ 烷基、 $C_{1-2}$ 卤代烷基、 $C_{1-4}$ 烷氧基、 $C_{1-2}$ 卤代烷氧基、 $C_{1-2}$ 烷硫基或苯基;

$R^2$  为取代或未取代的单核或双核芳环系统, 除碳原子外, 它还可以含有 1—4 个氮原子和 1—2 个氮原子和氧或硫原子或氧或硫原子作为环成员。

还优选下述通式 1 化合物, 其中

n 为 0;

X 为 O;

Y 为五元杂芳环系, 除  $R^2$  外, 它可还以带有 1—2 个选自 Cl、 $CH_3$ 、 $CF_3$  和  $OCH_3$  的基团;

$R^2$  为取代或未取代的单核或双核芳环系统, 除碳原子外, 它还可以含有 1—4 个氮原子和 1—2 个氮原子和氧或硫原子或氧或硫原子作为环成员。

另外, 优选下述通式 1 化合物, 其中

n 为 0 或 1;

X 为 O 或 S;

Y 为五元杂芳环系, 除  $R^2$  外, 它可还以带有 1—2 个选自 Cl、 $CH_3$ 、 $CF_3$  和  $OCH_3$  的基团;

$R^1$  为卤原子、 $C_{1-4}$ 烷基、 $C_{1-2}$ 卤代烷基、 $C_{1-4}$ 烷氧基、 $C_{1-2}$ 卤代烷氧基、 $C_{1-2}$ 烷硫基或苯基;

$R^2$  为取代或未取代的苯基。

还优选下述通式 I 化合物, 其中

n 为 0;

X 为 O;

Y 为五元杂芳环系, 除  $R^2$  外, 它可还以带有 1—2 个选自 Cl、 $CH_3$ 、 $CF_3$  和  $OCH_3$  的基团;

$R^2$  为取代或未取代的苯基。

也优选下述通式 I 化合物, 其中

n 为 0 或 1;

X 为 O 或 S;

Y 为五元杂芳环系, 除  $R^2$  外, 它可还以带有 1—2 个选自 Cl、 $CH_3$ 、 $CF_3$  和  $OCH_3$  的基团;

$R^1$  为卤原子、 $C_{1-4}$ 烷基、 $C_{1-2}$ 卤代烷基、 $C_{1-4}$ 烷氧基、 $C_{1-2}$ 卤代烷氧基、 $C_{1-2}$ 烷硫基或苯基;

$R^2$  为取代或未取代的五元杂芳环。

还优选下述通式 I 化合物, 其中

n 为 0 或 1;

X 为 O 或 S;

Y 为六元杂芳环系, 除  $R^2$  外, 它可还以带有 1—2 个选自 Cl、

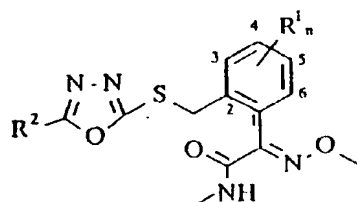
$\text{CH}_3$ 、 $\text{CF}_3$  和  $\text{OCH}_3$  的基团；

$\text{R}^2$  为取代或未取代的六元杂芳环。

特别优选的式 1.1、1.2、1.3、1.4、1.5、1.6、1.7、1.8、1.9、1.10、1.11 和 1.12 化合物列于下表 A.1、A.2、A.3、A.4、A.5、A.6、A.7、A.8、A.9、A.10、A.11 和 A.12 中。

表

表 A - 1



I.1

No.	R <sup>1</sup> <sub>n</sub>	R <sup>2</sup>
1.001	H	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>
1.002	3-Cl	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>
1.003	4-Cl	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>
1.004	6-Cl	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>
1.005	4-F	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>
1.006	4-OCH <sub>3</sub>	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>
1.007	3-CH <sub>3</sub>	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>
1.008	6-CH <sub>3</sub>	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>
1.009	H	2-F-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
1.010	H	3-F-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
1.011	H	4-F-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
1.012	H	2,3-F <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
1.013	H	2,4-F <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
1.014	H	2,5-F <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
1.015	H	2,6-F <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
1.016	H	3,4-F <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
1.017	H	3,5-F <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
1.018	H	2-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
1.019	H	3-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
1.020	H	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
1.021	3-Cl	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
1.022	4-Cl	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
1.023	6-Cl	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
1.024	4-F	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
1.025	4-OCH <sub>3</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
1.026	3-CH <sub>3</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
1.027	6-CH <sub>3</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
1.028	H	2,3-Cl <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
1.029	H	2,4-Cl <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
1.030	H	2,5-Cl <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
1.031	H	2,6-Cl <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
1.032	H	3,4-Cl <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>

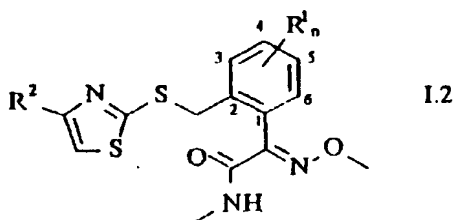
No.	R <sup>1</sup> <sub>n</sub>	R <sup>2</sup>
1.033	H	3,5-Cl <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
1.034	H	2,3,4-Cl <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>2</sub>
1.035	H	2,3,5-Cl <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>2</sub>
1.036	H	2,3,6-Cl <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>2</sub>
1.037	H	2,4,5-Cl <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>2</sub>
1.038	H	2,4,6-Cl <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>2</sub>
1.039	H	3,4,5-Cl <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>2</sub>
1.040	H	2-Br-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
1.041	H	3-Br-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
1.042	H	4-Br-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
1.043	H	2,4-Br <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
1.044	H	2-Br, 4-F-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
1.045	H	2-Br, 4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
1.046	H	2-F, 4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
1.047	H	3-F, 4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
1.048	H	3-Cl, 5-F-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
1.049	H	2-Cl, 4-F-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
1.050	H	2-CN-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
1.051	H	3-CN-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
1.052	H	4-CN-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
1.053	H	3-CN, 4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
1.054	H	4-NO <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
1.055	H	4-H <sub>2</sub> N-C(=S)-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
1.056	H	2-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
1.057	H	3-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
1.058	H	4-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
1.059	H	2,4-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
1.060	H	2,5-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
1.061	H	2,5-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
1.062	H	2,6-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
1.063	H	3,4-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
1.064	H	3,5-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
1.065	H	2,4,6-(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>2</sub>
1.066	H	3,4,5-(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>2</sub>
1.067	H	2-CH <sub>3</sub> , 4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
1.068	H	2-Cl, 4-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
1.069	H	3-CH <sub>3</sub> , 4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
1.070	H	3-Cl, 5-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
1.071	H	2-CN, 4-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
1.072	H	2-CH <sub>3</sub> , 4-CN-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
1.073	H	4-(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> )-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
1.074	H	4-[C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> ]-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
1.075	H	3-(C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> )-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
1.076	H	4-(C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> )-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
1.077	H	2-CF <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>

No.	R <sup>1</sup> <sub>n</sub>	R <sup>2</sup>
1.078	H	3-CF <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
1.079	H	4-CF <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
1.080	H	3,5-(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
1.081	H	2-Cl, 4-CF <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
1.082	H	2-OCH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
1.083	H	3-OCH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
1.084	H	4-OCH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
1.085	H	2,4-(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
1.086	H	3,4-(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
1.087	H	2,5-(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
1.088	H	3,5-(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
1.089	H	3,4,5-(OCH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>2</sub>
1.090	H	2-CH <sub>3</sub> , 4-OCH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
1.091	H	2-Cl, 4-OCH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
1.092	H	4-OCF <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
1.093	H	2-OCHF <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
1.094	H	3-OCHF <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
1.095	H	4-OCHF <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
1.096	H	4-(OCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub> )-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
1.097	H	2-F, 4-OCHF <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
1.098	H	4-(OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> )-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
1.099	H	4-[OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> ]-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
1.100	H	3-(CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> )-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
1.101	H	4-(CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> )-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
1.102	H	4-[CO <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> ]-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
1.103	H	2,3-[O-CH <sub>2</sub> -O]-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
1.104	H	3,4-[O-CH <sub>2</sub> -O]-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
1.105	H	3,4-[O-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -O]-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
1.106	H	3,4-[O-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -O]-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
1.107	H	2,3-[(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> ]-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
1.108	H	3,4-[(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> ]-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
1.109	H	2,3-(CH=CH <sub>2</sub> -CH=CH)-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
1.110	H	3,4-(CH=CH-CH=CH)-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
1.111	H	CH <sub>3</sub>
1.112	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
1.113	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
1.114	H	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
1.115	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
1.116	H	CHCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
1.117	H	CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
1.118	H	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>
1.119	H	环丙基
1.120	H	环己基
1.121	H	2-四氢呋喃基
1.122	H	3-四氢呋喃基



No.	R <sup>1</sup> <sub>n</sub>	R <sup>2</sup>
1.123	H	3-四氢噻吩基
1.124	H	2-1, 3-二氧戊环基
1.125	H	2-1, 3-二噁烷基
1.126	H	4-四氢吡喃基

表 A - 2



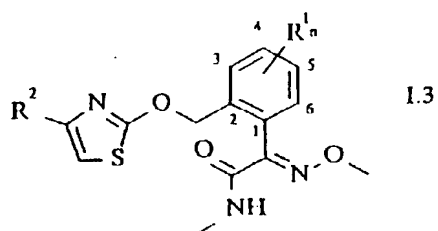
No.	R <sup>1</sup> <sub>n</sub>	R <sup>2</sup>
2.001	H	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>
2.002	3-Cl	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>
2.003	4-Cl	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>
2.004	6-Cl	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>
2.005	4-F	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>
2.006	4-OCH <sub>3</sub>	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>
2.007	3-CH <sub>3</sub>	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>
2.008	6-CH <sub>3</sub>	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>
2.009	H	2-F-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
2.010	H	3-F-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
2.011	H	4-F-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
2.012	H	2,3-F <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
2.013	H	2,4-F <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
2.014	H	2,5-F <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
2.015	H	2,6-F <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
2.016	H	3,4-F <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
2.017	H	3,5-F <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
2.018	H	2-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
2.019	H	3-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
2.020	H	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
2.021	3-Cl	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
2.022	4-Cl	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
2.023	6-Cl	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
2.024	4-F	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
2.025	4-OCH <sub>3</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
2.026	3-CH <sub>3</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
2.027	6-CH <sub>3</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>

No.	R <sup>1</sup> <sub>n</sub>	R <sup>2</sup>
2.028	H	2,3-Cl <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
2.029	H	2,4-Cl <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
2.030	H	2,5-Cl <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
2.031	H	2,6-Cl <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
2.032	H	3,4-Cl <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
2.033	H	3,5-Cl <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
2.034	H	2,3,4-Cl <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>2</sub>
2.035	H	2,3,5-Cl <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>2</sub>
2.036	H	2,3,6-Cl <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>2</sub>
2.037	H	2,4,5-Cl <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>2</sub>
2.038	H	2,4,6-Cl <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>2</sub>
2.039	H	3,4,5-Cl <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>2</sub>
2.040	H	2-Br-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
2.041	H	3-Br-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
2.042	H	4-Br-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
2.043	H	2,4-Br <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
2.044	H	2-Br, 4-F-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
2.045	H	2-Br, 4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
2.046	H	2-F, 4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
2.047	H	3-F, 4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
2.048	H	3-Cl, 5-F-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
2.049	H	2-Cl, 4-F-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
2.050	H	2-CN-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
2.051	H	3-CN-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
2.052	H	4-CN-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
2.053	H	3-CN, 4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
2.054	H	4-NO <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
2.055	H	4-H <sub>2</sub> N-C(=S)-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
2.056	H	2-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
2.057	H	3-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
2.058	H	4-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
2.059	H	2,4-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
2.060	H	2,5-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
2.061	H	2,5-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
2.062	H	2,6-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
2.063	H	3,4-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
2.064	H	3,5-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
2.065	H	2,4,6-(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>2</sub>
2.066	H	3,4,5-(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>2</sub>
2.067	H	2-CH <sub>3</sub> , 4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
2.068	H	2-Cl, 4-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
2.069	H	3-CH <sub>3</sub> , 4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
2.070	H	3-Cl, 5-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
2.071	H	2-CN, 4-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
2.072	H	2-CH <sub>3</sub> , 4-CN-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>

No.	R <sup>1</sup> <sub>n</sub>	R <sup>2</sup>
2.073	H	4-(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> )-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
2.074	H	4-[C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> ]-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
2.075	H	3-(C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> )-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
2.076	H	4-(C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> )-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
2.077	H	2-CF <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
2.078	H	3-CF <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
2.079	H	4-CF <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
2.080	H	3,5-(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
2.081	H	2-Cl, 4-CF <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
2.082	H	2-OCH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
2.083	H	3-OCH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
2.084	H	4-OCH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
2.085	H	2,4-(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
2.086	H	3,4-(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
2.087	H	2,5-(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
2.088	H	3,5-(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
2.089	H	3,4,5-(OCH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>2</sub>
2.090	H	2-CH <sub>3</sub> , 4-OCH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
2.091	H	2-Cl, 4-OCH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
2.092	H	4-OCF <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
2.093	H	2-OCHF <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
2.094	H	3-OCHF <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
2.095	H	4-OCHF <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
2.096	H	4-(OCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub> )-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
2.097	H	2-F, 4-OCHF <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
2.098	H	4-(OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> )-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
2.099	H	4-[OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> ]-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
2.100	H	3-(CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> )-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
2.101	H	4-(CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> )-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
2.102	H	4-[CO <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> ]-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
2.103	H	2,3-[O-CH <sub>2</sub> -O]-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
2.104	H	3,4-[O-CH <sub>2</sub> -O]-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
2.105	H	3,4-[O-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -O]-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
2.106	H	3,4-[O-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -O]-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
2.107	H	2,3-[(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> ]-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
2.108	H	3,4-[(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> ]-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
2.109	H	2,3-(CH=CH <sub>2</sub> -CH=CH)-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
2.110	H	3,4-(CH=CH-CH=CH)-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
2.111	H	CH <sub>3</sub>
2.112	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
2.113	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
2.114	H	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
2.115	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
2.116	H	CHCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
2.117	H	CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>

No.	R <sup>1</sup> <sub>n</sub>	R <sup>2</sup>
2.118	H	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>
2.119	H	环丙基
2.120	H	环己基
2.121	H	2-四氢呋喃基
2.122	H	3-四氢呋喃基
2.123	H	3-四氢噻吩基
2.124	H	2-1,3-二氧戊环基
2.125	H	2-1,3-二噁烷基
2.126	H	4-四氢吡喃基

表 A-3



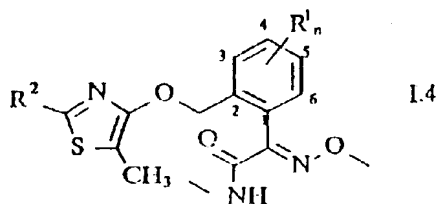
No.	R <sup>1</sup> <sub>n</sub>	R <sup>2</sup>
3.001	H	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>
3.002	3-Cl	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>
3.003	4-Cl	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>
3.004	6-Cl	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>
3.005	4-F	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>
3.006	4-OCH <sub>3</sub>	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>
3.007	3-CH <sub>3</sub>	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>
3.008	6-CH <sub>3</sub>	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>
3.009	H	2-F-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
3.010	H	3-F-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
3.011	H	4-F-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
3.012	H	2,3-F <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
3.013	H	2,4-F <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
3.014	H	2,5-F <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
3.015	H	2,6-F <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
3.016	H	3,4-F <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
3.017	H	3,5-F <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
3.018	H	2-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
3.019	H	3-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
3.020	H	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
3.021	3-Cl	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
3.022	4-Cl	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>

No.	R <sup>1</sup> <sub>n</sub>	R <sup>2</sup>
3.023	6-Cl	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
3.024	4-F	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
3.025	4-OCH <sub>3</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
3.026	3-CH <sub>3</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
3.027	6-CH <sub>3</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
3.028	H	2,3-Cl <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
3.029	H	2,4-Cl <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
3.030	H	2,5-Cl <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
3.031	H	2,6-Cl <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
3.032	H	3,4-Cl <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
3.033	H	3,5-Cl <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
3.034	H	2,3,4-Cl <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>2</sub>
3.035	H	2,3,5-Cl <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>2</sub>
3.036	H	2,3,6-Cl <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>2</sub>
3.037	H	2,4,5-Cl <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>2</sub>
3.038	H	2,4,6-Cl <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>2</sub>
3.039	H	3,4,5-Cl <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>2</sub>
3.040	H	2-Br-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
3.041	H	3-Br-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
3.042	H	4-Br-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
3.043	H	2,4-Br <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
3.044	H	2-Br, 4-F-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
3.045	H	2-Br, 4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
3.046	H	2-F, 4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
3.047	H	3-F, 4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
3.048	H	3-Cl, 5-F-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
3.049	H	2-Cl, 4-F-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
3.050	H	2-CN-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
3.051	H	3-CN-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
3.052	H	4-CN-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
3.053	H	3-CN, 4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
3.054	H	4-NO <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
3.055	H	4-H <sub>2</sub> N-C(=S)-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
3.056	H	2-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
3.057	H	3-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
3.058	H	4-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
3.059	H	2,4-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
3.060	H	2,5-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
3.061	H	2,5-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
3.062	H	2,6-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
3.063	H	3,4-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
3.064	H	3,5-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
3.065	H	2,4,6-(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>2</sub>
3.066	H	3,4,5-(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>2</sub>
3.067	H	2-CH <sub>3</sub> , 4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>

No.	R <sup>1</sup> <sub>a</sub>	R <sup>2</sup>
3.068	H	2-Cl, 4-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
3.069	H	3-CH <sub>3</sub> , 4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
3.070	H	3-Cl, 5-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
3.071	H	2-CN, 4-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
3.072	H	2-CH <sub>3</sub> , 4-CN-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
3.073	H	4-(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> )-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
3.074	H	4-[C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> ]-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
3.075	H	3-(C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> )-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
3.076	H	4-(C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> )-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
3.077	H	2-CF <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
3.078	H	3-CF <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
3.079	H	4-CF <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
3.080	H	3,5-(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
3.081	H	2-Cl, 4-CF <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
3.082	H	2-OCH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
3.083	H	3-OCH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
3.084	H	4-OCH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
3.085	H	2,4-(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
3.086	H	3,4-(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
3.087	H	2,5-(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
3.088	H	3,5-(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
3.089	H	3,4,5-(OCH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>2</sub>
3.090	H	2-CH <sub>3</sub> , 4-OCH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
3.091	H	2-Cl, 4-OCH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
3.092	H	4-OCF <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
3.093	H	2-OCHF <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
3.094	H	3-OCHF <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
3.095	H	4-OCHF <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
3.096	H	4-(OCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub> )-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
3.097	H	2-F, 4-OCHF <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
3.098	H	4-(OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> )-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
3.099	H	4-[OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> ]-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
3.100	H	3-(CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> )-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
3.101	H	4-(CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> )-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
3.102	H	4-[CO <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> ]-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
3.103	H	2,3-[O-CH <sub>2</sub> -O]-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
3.104	H	3,4-[O-CH <sub>2</sub> -O]-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
3.105	H	3,4-[O-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -O]-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
3.106	H	3,4-[O-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -O]-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
3.107	H	2,3-[(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> ]-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
3.108	H	3,4-[(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> ]-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
3.109	H	2,3-(CH=CH <sub>2</sub> -CH=CH)-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
3.110	H	3,4-(CH=CH-CH=CH)-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
3.111	H	CH <sub>3</sub>
3.112	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>

No.	R <sup>1</sup> <sub>n</sub>	R <sup>2</sup>
3.113	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
3.114	H	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
3.115	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
3.116	H	CHCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
3.117	H	CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
3.118	H	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>
3.119	H	环丙基
3.120	H	环己基
3.121	H	2-四氢呋喃基
3.122	H	3-四氢呋喃基
3.123	H	3-四氢噻吩基
3.124	H	2-1, 3-二氧戊环基
3.125	H	2-1, 3-二噁烷基
3.126	H	4-四氢吡喃基

表 A-4



No.	R <sup>1</sup> <sub>n</sub>	R <sup>2</sup>
4.001	H	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>
4.002	3-Cl	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>
4.003	4-Cl	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>
4.004	6-Cl	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>
4.005	4-F	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>
4.006	4-OCH <sub>3</sub>	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>
4.007	3-CH <sub>3</sub>	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>
4.008	6-CH <sub>3</sub>	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>
4.009	H	2-F-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
4.010	H	3-F-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
4.011	H	4-F-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
4.012	H	2,3-F <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
4.013	H	2,4-F <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
4.014	H	2,5-F <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
4.015	H	2,6-F <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
4.016	H	3,4-F <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
4.017	H	3,5-F <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>

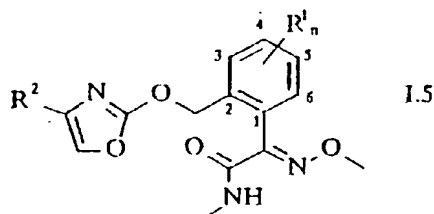
No.	R <sup>1</sup> <sub>n</sub>	R <sup>2</sup>
4.018	H	2-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
4.019	H	3-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
4.020	H	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
4.021	3-Cl	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
4.022	4-Cl	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
4.023	6-Cl	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
4.024	4-F	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
4.025	4-OCH <sub>3</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
4.026	3-CH <sub>3</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
4.027	6-CH <sub>3</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
4.028	H	2,3-Cl <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
4.029	H	2,4-Cl <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
4.030	H	2,5-Cl <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
4.031	H	2,6-Cl <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
4.032	H	3,4-Cl <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
4.033	H	3,5-Cl <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
4.034	H	2,3,4-Cl <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>2</sub>
4.035	H	2,3,5-Cl <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>2</sub>
4.036	H	2,3,6-Cl <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>2</sub>
4.037	H	2,4,5-Cl <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>2</sub>
4.038	H	2,4,6-Cl <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>2</sub>
4.039	H	3,4,5-Cl <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>2</sub>
4.040	H	2-Br-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
4.041	H	3-Br-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
4.042	H	4-Br-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
4.043	H	2,4-Br <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
4.044	H	2-Br, 4-F-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
4.045	H	2-Br, 4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
4.046	H	2-F, 4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
4.047	H	3-F, 4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
4.048	H	3-Cl, 5-F-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
4.049	H	2-Cl, 4-F-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
4.050	H	2-CN-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
4.051	H	3-CN-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
4.052	H	4-CN-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
4.053	H	3-CN, 4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
4.054	H	4-NO <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
4.055	H	4-H <sub>2</sub> N-C(=S)-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
4.056	H	2-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
4.057	H	3-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
4.058	H	4-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
4.059	H	2,4-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
4.060	H	2,5-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
4.061	H	2,5-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
4.062	H	2,6-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>



No.	R <sup>1</sup> <sub>n</sub>	R <sup>2</sup>
4.063	H	3,4-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
4.064	H	3,5-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
4.065	H	2,4,6-(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>2</sub>
4.066	H	3,4,5-(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>2</sub>
4.067	H	2-CH <sub>3</sub> , 4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
4.068	H	2-Cl, 4-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
4.069	H	3-CH <sub>3</sub> , 4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
4.070	H	3-Cl, 5-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
4.071	H	2-CN, 4-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
4.072	H	2-CH <sub>3</sub> , 4-CN-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
4.073	H	4-(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> )-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
4.074	H	4-[C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> ]-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
4.075	H	3-(C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> )-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
4.076	H	4-(C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> )-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
4.077	H	2-CF <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
4.078	H	3-CF <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
4.079	H	4-CF <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
4.080	H	3,5-(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
4.081	H	2-Cl, 4-CF <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
4.082	H	2-OCH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
4.083	H	3-OCH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
4.084	H	4-OCH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
4.085	H	2,4-(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
4.086	H	3,4-(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
4.087	H	2,5-(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
4.088	H	3,5-(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
4.089	H	3,4,5-(OCH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>2</sub>
4.090	H	2-CH <sub>3</sub> , 4-OCH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
4.091	H	2-Cl, 4-OCH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
4.092	H	4-OCF <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
4.093	H	2-OCHF <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
4.094	H	3-OCHF <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
4.095	H	4-OCHF <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
4.096	H	4-(OCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub> )-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
4.097	H	2-F, 4-OCHF <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
4.098	H	4-(OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> )-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
4.099	H	4-[OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> ]-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
4.100	H	3-(CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> )-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
4.101	H	4-(CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> )-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
4.102	H	4-[CO <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> ]-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
4.103	H	2,3-[O-CH <sub>2</sub> -O]-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
4.104	H	3,4-[O-CH <sub>2</sub> -O]-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
4.105	H	3,4-[O-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -O]-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
4.106	H	3,4-[O-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -O]-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
4.107	H	2,3-[(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> ]-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>

No.	R <sup>1</sup> <sub>n</sub>	R <sup>2</sup>
4.108	H	3,4-[(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> ]-C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>
4.109	H	2,3-(CH=CH <sub>2</sub> -CH=CH)-C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>
4.110	H	3,4-(CH=CH-CH=CH)-C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>
4.111	H	CH <sub>3</sub>
4.112	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
4.113	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
4.114	H	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
4.115	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
4.116	H	CHCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
4.117	H	CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
4.118	H	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>
4.119	H	环丙基
4.120	H	环己基
4.121	H	2-四氢呋喃基
4.122	H	3-四氢呋喃基
4.123	H	3-四氢噻吩基
4.124	H	2-1,3-二氧戊环基
4.125	H	2-1,3-二噁烷基
4.126	H	4-四氢吡喃基

表 A . 5



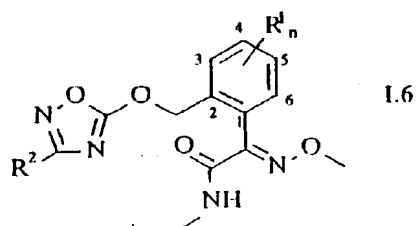
No.	R <sup>1</sup> <sub>n</sub>	R <sup>2</sup>
5.001	H	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>
5.002	3-Cl	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>
5.003	4-Cl	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>
5.004	6-Cl	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>
5.005	4-F	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>
5.006	4-OCH <sub>3</sub>	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>
5.007	3-CH <sub>3</sub>	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>
5.008	6-CH <sub>3</sub>	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>
5.009	H	2-F-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
5.010	H	3-F-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
5.011	H	4-F-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
5.012	H	2,3-F <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>

No.	R <sup>1</sup> <sub>n</sub>	R <sup>2</sup>
5.013	H	2,4-F <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
5.014	H	2,5-F <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
5.015	H	2,6-F <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
5.016	H	3,4-F <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
5.017	H	3,5-F <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
5.018	H	2-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
5.019	H	3-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
5.020	H	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
5.021	3-Cl	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
5.022	4-Cl	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
5.023	6-Cl	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
5.024	4-F	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
5.025	4-OCH <sub>3</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
5.026	3-CH <sub>3</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
5.027	6-CH <sub>3</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
5.028	H	2,3-Cl <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
5.029	H	2,4-Cl <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
5.030	H	2,5-Cl <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
5.031	H	2,6-Cl <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
5.032	H	3,4-Cl <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
5.033	H	3,5-Cl <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
5.034	H	2,3,4-Cl <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>2</sub>
5.035	H	2,3,5-Cl <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>2</sub>
5.036	H	2,3,6-Cl <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>2</sub>
5.037	H	2,4,5-Cl <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>2</sub>
5.038	H	2,4,6-Cl <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>2</sub>
5.039	H	3,4,5-Cl <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>2</sub>
5.040	H	2-Br-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
5.041	H	3-Br-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
5.042	H	4-Br-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
5.043	H	2,4-Br <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
5.044	H	2-Br, 4-F-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
5.045	H	2-Br, 4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
5.046	H	2-F, 4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
5.047	H	3-F, 4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
5.048	H	3-Cl, 5-F-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
5.049	H	2-Cl, 4-F-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
5.050	H	2-CN-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
5.051	H	3-CN-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
5.052	H	4-CN-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
5.053	H	3-CN, 4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
5.054	H	4-NO <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
5.055	H	4-N <sub>3</sub> N-C(=S)-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
5.056	H	2-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
5.057	H	3-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>

No.	R <sup>1</sup> <sub>n</sub>	R <sup>2</sup>
5.058	H	4-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
5.059	H	2,4-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
5.060	H	2,5-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
5.061	H	2,5-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
5.062	H	2,6-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
5.063	H	3,4-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
5.064	H	3,5-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
5.065	H	2,4,6-(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>2</sub>
5.066	H	3,4,5-(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>2</sub>
5.067	H	2-CH <sub>3</sub> , 4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
5.068	H	2-Cl, 4-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
5.069	H	3-CH <sub>3</sub> , 4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
5.070	H	3-Cl, 5-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
5.071	H	2-CN, 4-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
5.072	H	2-CH <sub>3</sub> , 4-CN-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
5.073	H	4-(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> )-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
5.074	H	4-[C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> ]-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
5.075	H	3-(C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> )-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
5.076	H	4-(C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> )-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
5.077	H	2-CF <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
5.078	H	3-CF <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
5.079	H	4-CF <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
5.080	H	3,5-(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
5.081	H	2-Cl, 4-CF <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
5.082	H	2-OCH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
5.083	H	3-OCH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
5.084	H	4-OCH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
5.085	H	2,4-(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
5.086	H	3,4-(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
5.087	H	2,5-(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
5.088	H	3,5-(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
5.089	H	3,4,5-(OCH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>2</sub>
5.090	H	2-CH <sub>3</sub> , 4-OCH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
5.091	H	2-Cl, 4-OCH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
5.092	H	4-OCF <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
5.093	H	2-OCHF <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
5.094	H	3-OCHF <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
5.095	H	4-OCHF <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
5.096	H	4-(OCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub> )-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
5.097	H	2-F, 4-OCHF <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
5.098	H	4-(OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> )-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
5.099	H	4-[OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> ]-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
5.100	H	3-(CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> )-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
5.101	H	4-(CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> )-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
5.102	H	4-[CO <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> ]-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>

No.	R <sup>1</sup> <sub>n</sub>	R <sup>2</sup>
5.103	H	2,3-[O-CH <sub>2</sub> -O]-C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>
5.104	H	3,4-[O-CH <sub>2</sub> -O]-C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>
5.105	H	3,4-[O-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -O]-C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>
5.106	H	3,4-[O-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -O]-C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>
5.107	H	2,3-[(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> ]-C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>
5.108	H	3,4-[(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> ]-C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>
5.109	H	2,3-(CH=CH <sub>2</sub> -CH=CH)-C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>
5.110	H	3,4-(CH=CH-CH=CH)-C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>
5.111	H	CH <sub>3</sub>
5.112	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
5.113	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
5.114	H	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
5.115	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
5.116	H	CHCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
5.117	H	CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
5.118	H	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>
5.119	H	环丙基
5.120	H	环己基
5.121	H	2-四氢呋喃基
5.122	H	3-四氢呋喃基
5.123	H	3-四氢噻吩基
5.124	H	2-1,3-二氧戊环基
5.125	H	2-1,3-二噁烷基
5.126	H	4-四氢吡喃基

表 A - 6



No.	R <sup>1</sup> <sub>n</sub>	R <sup>2</sup>
6.001	H	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>
6.002	3-Cl	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>
6.003	4-Cl	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>
6.004	6-Cl	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>
6.005	4-F	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>
6.006	4-OCH <sub>3</sub>	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>
6.007	3-CH <sub>3</sub>	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>

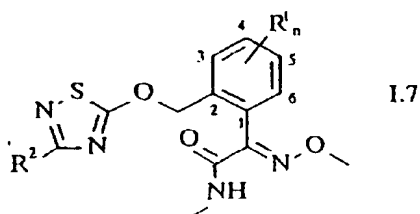
No.	R <sup>1</sup> <sub>n</sub>	R <sup>2</sup>
6.008	6-CH <sub>3</sub>	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>
6.009	H	2-F-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
6.010	H	3-F-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
6.011	H	4-F-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
6.012	H	2,3-F <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
6.013	H	2,4-F <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
6.014	H	2,5-F <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
6.015	H	2,6-F <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
6.016	H	3,4-F <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
6.017	H	3,5-F <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
6.018	H	2-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
6.019	H	3-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
6.020	H	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
6.021	3-Cl	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
6.022	4-Cl	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
6.023	6-Cl	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
6.024	4-F	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
6.025	4-OCH <sub>3</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
6.026	3-CH <sub>3</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
6.027	6-CH <sub>3</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
6.028	H	2,3-Cl <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
6.029	H	2,4-Cl <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
6.030	H	2,5-Cl <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
6.031	H	2,6-Cl <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
6.032	H	3,4-Cl <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
6.033	H	3,5-Cl <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
6.034	H	2,3,4-Cl <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>2</sub>
6.035	H	2,3,5-Cl <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>2</sub>
6.036	H	2,3,6-Cl <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>2</sub>
6.037	H	2,4,5-Cl <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>2</sub>
6.038	H	2,4,6-Cl <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>2</sub>
6.039	H	3,4,5-Cl <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>2</sub>
6.040	H	2-Br-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
6.041	H	3-Br-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
6.042	H	4-Br-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
6.043	H	2,4-Br <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
6.044	H	2-Br, 4-F-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
6.045	H	2-Br, 4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
6.046	H	2-F, 4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
6.047	H	3-F, 4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
6.048	H	3-Cl, 5-F-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
6.049	H	2-Cl, 4-F-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
6.050	H	2-CN-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
6.051	H	3-CN-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
6.052	H	4-CN-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>

No.	R <sup>1</sup> <sub>n</sub>	R <sup>2</sup>
6.053	H	3-CN, 4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
6.054	H	4-NO <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
6.055	H	4-H <sub>2</sub> N-C(=S)-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
6.056	H	2-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
6.057	H	3-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
6.058	H	4-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
6.059	H	2,4-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
6.060	H	2,5-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
6.061	H	2,5-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
6.062	H	2,6-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
6.063	H	3,4-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
6.064	H	3,5-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
6.065	H	2,4,6-(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>2</sub>
6.066	H	3,4,5-(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>2</sub>
6.067	H	2-CH <sub>3</sub> , 4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
6.068	H	2-Cl, 4-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
6.069	H	3-CH <sub>3</sub> , 4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
6.070	H	3-Cl, 5-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
6.071	H	2-CN, 4-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
6.072	H	2-CH <sub>3</sub> , 4-CN-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
6.073	H	4-(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> )-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
6.074	H	4-[C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> ]-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
6.075	H	3-(C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> )-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
6.076	H	4-(C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> )-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
6.077	H	2-CF <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
6.078	H	3-CF <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
6.079	H	4-CF <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
6.080	H	3,5-(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
6.081	H	2-Cl, 4-CF <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
6.082	H	2-OCH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
6.083	H	3-OCH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
6.084	H	4-OCH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
6.085	H	2,4-(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
6.086	H	3,4-(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
6.087	H	2,5-(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
6.088	H	3,5-(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
6.089	H	3,4,5-(OCH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>2</sub>
6.090	H	2-CH <sub>3</sub> , 4-OCH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
6.091	H	2-Cl, 4-OCH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
6.092	H	4-OCF <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
6.093	H	2-OCHF <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
6.094	H	3-OCHF <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
6.095	H	4-OCHF <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
6.096	H	4-(OCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub> )-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
6.097	H	2-F, 4-OCHF <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>

No.	R <sup>1</sup> <sub>n</sub>	R <sup>2</sup>
6.098	H	4-(OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> )-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
6.099	H	4-[OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> ]-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
6.100	H	3-(CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> )-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
6.101	H	4-(CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> )-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
6.102	H	4-[CO <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> ]-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
6.103	H	2,3-[O-CH <sub>2</sub> -O]-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
6.104	H	3,4-[O-CH <sub>2</sub> -O]-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
6.105	H	3,4-[O-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -O]-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
6.106	H	3,4-[O-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -O]-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
6.107	H	2,3-[(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> ]-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
6.108	H	3,4-[(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> ]-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
6.109	H	2,3-(CH=CH <sub>2</sub> -CH=CH)-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
6.110	H	3,4-(CH=CH-CH=CH)-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
6.111	H	CH <sub>3</sub>
6.112	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
6.113	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
6.114	H	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
6.115	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
6.116	H	CHCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
6.117	H	CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
6.118	H	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>
6.119	H	环丙基
6.120	H	环己基
6.121	H	2-四氢呋喃基
6.122	H	3-四氢呋喃基
6.123	H	3-四氢噻吩基
6.124	H	2-1,3-二氧戊环基
6.125	H	2-1,3-二噁烷基
6.126	H	4-四氢吡喃基



表 A · 7



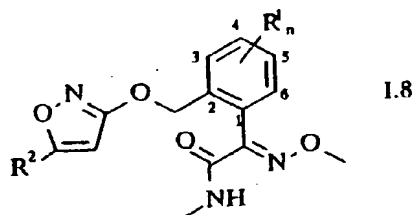
No.	R <sup>1</sup> <sub>n</sub>	R <sup>2</sup>
7.001	H	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>
7.002	3-Cl	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>
7.003	4-Cl	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>
7.004	6-Cl	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>
7.005	4-F	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>
7.006	4-OCH <sub>3</sub>	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>
7.007	3-CH <sub>3</sub>	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>
7.008	6-CH <sub>3</sub>	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>
7.009	H	2-F-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
7.010	H	3-F-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
7.011	H	4-F-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
7.012	H	2,3-F <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
7.013	H	2,4-F <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
7.014	H	2,5-F <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
7.015	H	2,6-F <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
7.016	H	3,4-F <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
7.017	H	3,5-F <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
7.018	H	2-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
7.019	H	3-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
7.020	H	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
7.021	3-Cl	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
7.022	4-Cl	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
7.023	6-Cl	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
7.024	4-F	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
7.025	4-OCH <sub>3</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
7.026	3-CH <sub>3</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
7.027	6-CH <sub>3</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
7.028	H	2,3-Cl <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
7.029	H	2,4-Cl <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
7.030	H	2,5-Cl <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
7.031	H	2,6-Cl <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
7.032	H	3,4-Cl <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
7.033	H	3,5-Cl <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
7.034	H	2,3,4-Cl <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>2</sub>

No.	R <sup>1</sup> <sub>n</sub>	R <sup>2</sup>
7.035	H	2,3,5-Cl <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>2</sub>
7.036	H	2,3,6-Cl <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>2</sub>
7.037	H	2,4,5-Cl <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>2</sub>
7.038	H	2,4,6-Cl <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>2</sub>
7.039	H	3,4,5-Cl <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>2</sub>
7.040	H	2-Br-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
7.041	H	3-Br-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
7.042	H	4-Br-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
7.043	H	2,4-Br <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
7.044	H	2-Br, 4-F-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
7.045	H	2-Br, 4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
7.046	H	2-F, 4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
7.047	H	3-F, 4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
7.048	H	3-Cl, 5-F-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
7.049	H	2-Cl, 4-F-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
7.050	H	2-CN-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
7.051	H	3-CN-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
7.052	H	4-CN-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
7.053	H	3-CN, 4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
7.054	H	4-NO <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
7.055	H	4-H <sub>2</sub> N-C(=S)-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
7.056	H	2-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
7.057	H	3-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
7.058	H	4-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
7.059	H	2,4-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
7.060	H	2,5-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
7.061	H	2,5-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
7.062	H	2,6-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
7.063	H	3,4-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
7.064	H	3,5-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
7.065	H	2,4,6-(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>2</sub>
7.066	H	3,4,5-(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>2</sub>
7.067	H	2-CH <sub>3</sub> , 4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
7.068	H	2-Cl, 4-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
7.069	H	3-CH <sub>3</sub> , 4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
7.070	H	3-Cl, 5-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
7.071	H	2-CN, 4-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
7.072	H	2-CH <sub>3</sub> , 4-CN-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
7.073	H	4-(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> )-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
7.074	H	4-[C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> ]-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
7.075	H	3-(C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> )-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
7.076	H	4-(C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> )-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
7.077	H	2-CF <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
7.078	H	3-CF <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
7.079	H	4-CF <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>

No.	R <sup>1</sup> <sub>n</sub>	R <sup>2</sup>
7.080	H	3,5-(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
7.081	H	2-Cl, 4-CF <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
7.082	H	2-OCH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
7.083	H	3-OCH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
7.084	H	4-OCH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
7.085	H	2,4-(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
7.086	H	3,4-(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
7.087	H	2,5-(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
7.088	H	3,5-(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
7.089	H	3,4,5-(OCH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>2</sub>
7.090	H	2-CH <sub>3</sub> , 4-OCH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
7.091	H	2-Cl, 4-OCH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
7.092	H	4-OCF <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
7.093	H	2-OCHF <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
7.094	H	3-OCHF <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
7.095	H	4-OCHF <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
7.096	H	4-(OCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub> )-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
7.097	H	2-F, 4-OCHF <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
7.098	H	4-(OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> )-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
7.099	H	4-[OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> ]-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
7.100	H	3-(CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> )-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
7.101	H	4-(CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> )-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
7.102	H	4-[CO <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> ]-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
7.103	H	2,3-[O-CH <sub>2</sub> -O]-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
7.104	H	3,4-[O-CH <sub>2</sub> -O]-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
7.105	H	3,4-[O-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -O]-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
7.106	H	3,4-[O-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -O]-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
7.107	H	2,3-[(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> ]-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
7.108	H	3,4-[(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> ]-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
7.109	H	2,3-(CH=CH <sub>2</sub> -CH=CH)-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
7.110	H	3,4-(CH=CH-CH=CH)-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
7.111	H	CH <sub>3</sub>
7.112	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
7.113	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
7.114	H	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
7.115	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
7.116	H	CHCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
7.117	H	CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
7.118	H	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>
7.119	H	环丙基
7.120	H	环己基
7.121	H	2-四氢呋喃基
7.122	H	3-四氢呋喃基
7.123	H	3-四氢噻吩基
7.124	H	2-1,3-二氧戊环基

No.	R <sup>1</sup> <sub>n</sub>	R <sup>2</sup>
7.125	H	2-1, 3-二噁烷基
7.126	H	4-四氢吡喃基

表 A · 8



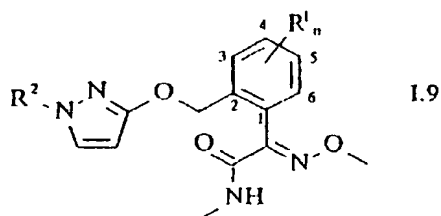
No.	R <sup>1</sup> <sub>n</sub>	R <sup>2</sup>
8.001	H	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>
8.002	3-Cl	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>
8.003	4-Cl	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>
8.004	6-Cl	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>
8.005	4-F	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>
8.006	4-OCH <sub>3</sub>	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>
8.007	3-CH <sub>3</sub>	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>
8.008	6-CH <sub>3</sub>	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>
8.009	H	2-F-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
8.010	H	3-F-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
8.011	H	4-F-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
8.012	H	2,3-F <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
8.013	H	2,4-F <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
8.014	H	2,5-F <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
8.015	H	2,6-F <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
8.016	H	3,4-F <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
8.017	H	3,5-F <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
8.018	H	2-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
8.019	H	3-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
8.020	H	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
8.021	3-Cl	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
8.022	4-Cl	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
8.023	6-Cl	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
8.024	4-F	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
8.025	4-OCH <sub>3</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
8.026	3-CH <sub>3</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
8.027	6-CH <sub>3</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
8.028	H	2,3-Cl <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
8.029	H	2,4-Cl <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>

No.	R <sup>1</sup> <sub>n</sub>	R <sup>2</sup>
8.030	H	2,5-Cl <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
8.031	H	2,6-Cl <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
8.032	H	3,4-Cl <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
8.033	H	3,5-Cl <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
8.034	H	2,3,4-Cl <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>2</sub>
8.035	H	2,3,5-Cl <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>2</sub>
8.036	H	2,3,6-Cl <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>2</sub>
8.037	H	2,4,5-Cl <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>2</sub>
8.038	H	2,4,6-Cl <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>2</sub>
8.039	H	3,4,5-Cl <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>2</sub>
8.040	H	2-Br-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
8.041	H	3-Br-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
8.042	H	4-Br-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
8.043	H	2,4-Br <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
8.044	H	2-Br, 4-F-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
8.045	H	2-Br, 4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
8.046	H	2-F, 4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
8.047	H	3-F, 4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
8.048	H	3-Cl, 5-F-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
8.049	H	2-Cl, 4-F-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
8.050	H	2-CN-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
8.051	H	3-CN-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
8.052	H	4-CN-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
8.053	H	3-CN, 4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
8.054	H	4-NO <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
8.055	H	4-H <sub>2</sub> N-C(=S)-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
8.056	H	2-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
8.057	H	3-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
8.058	H	4-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
8.059	H	2,4-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
8.060	H	2,5-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
8.061	H	2,5-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
8.062	H	2,6-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
8.063	H	3,4-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
8.064	H	3,5-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
8.065	H	2,4,6-(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>2</sub>
8.066	H	3,4,5-(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>2</sub>
8.067	H	2-CH <sub>3</sub> , 4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
8.068	H	2-Cl, 4-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
8.069	H	3-CH <sub>3</sub> , 4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
8.070	H	3-Cl, 5-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
8.071	H	2-CN, 4-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
8.072	H	2-CH <sub>3</sub> , 4-CN-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
8.073	H	4-(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> )-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
8.074	H	4-[C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> ]-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>

No.	R <sup>1</sup> <sub>n</sub>	R <sup>2</sup>
8.075	H	3-(C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> )-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
8.076	H	4-(C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> )-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
8.077	H	2-CF <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
8.078	H	3-CF <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
8.079	H	4-CF <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
8.080	H	3,5-(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
8.081	H	2-Cl, 4-CF <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
8.082	H	2-OCH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
8.083	H	3-OCH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
8.084	H	4-OCH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
8.085	H	2,4-(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
8.086	H	3,4-(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
8.087	H	2,5-(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
8.088	H	3,5-(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
8.089	H	3,4,5-(OCH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>2</sub>
8.090	H	2-CH <sub>3</sub> , 4-OCH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
8.091	H	2-Cl, 4-OCH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
8.092	H	4-OCF <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
8.093	H	2-OCHF <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
8.094	H	3-OCHF <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
8.095	H	4-OCHF <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
8.096	H	4-(OCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub> )-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
8.097	H	2-F, 4-OCHF <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
8.098	H	4-(OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> )-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
8.099	H	4-[OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> ]-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
8.100	H	3-(CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> )-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
8.101	H	4-(CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> )-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
8.102	H	4-[CO <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> ]-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
8.103	H	2,3-[O-CH <sub>2</sub> -O]-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
8.104	H	3,4-[O-CH <sub>2</sub> -O]-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
8.105	H	3,4-[O-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -O]-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
8.106	H	3,4-[O-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -O]-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
8.107	H	2,3-[(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> ]-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
8.108	H	3,4-[(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> ]-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
8.109	H	2,3-(CH=CH <sub>2</sub> -CH=CH)-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
8.110	H	3,4-(CH=CH-CH=CH)-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
8.111	H	CH <sub>3</sub>
8.112	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
8.113	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
8.114	H	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
8.115	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
8.116	H	CHCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
8.117	H	CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
8.118	H	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>
8.119	H	环丙基

No.	R <sup>1</sup> <sub>n</sub>	R <sup>2</sup>
8.120	H	环己基
8.121	H	2-四氢呋喃基
8.122	H	3-四氢呋喃基
8.123	H	3-四氢噻吩基
8.124	H	2-1, 3-二氧戊环基
8.125	H	2-1, 3-二噁烷基
8.126	H	4-四氢吡喃基

表 A · 9



No.	R <sup>1</sup> <sub>n</sub>	R <sup>2</sup>
9.001	H	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>
9.002	3-Cl	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>
9.003	4-Cl	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>
9.004	6-Cl	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>
9.005	4-F	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>
9.006	4-OCH <sub>3</sub>	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>
9.007	3-CH <sub>3</sub>	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>
9.008	6-CH <sub>3</sub>	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>
9.009	H	2-F-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
9.010	H	3-F-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
9.011	H	4-F-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
9.012	H	2, 3-F <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
9.013	H	2, 4-F <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
9.014	H	2, 5-F <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
9.015	H	2, 6-F <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
9.016	H	3, 4-F <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
9.017	H	3, 5-F <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
9.018	H	2-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
9.019	H	3-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
9.020	H	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
9.021	3-Cl	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
9.022	4-Cl	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
9.023	6-Cl	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
9.024	4-F	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>

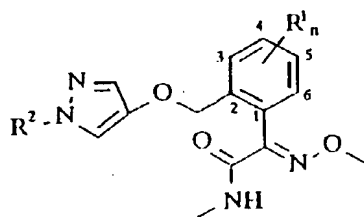
No.	R <sup>1</sup> <sub>n</sub>	R <sup>2</sup>
9.025	4-OCH <sub>3</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
9.026	3-CH <sub>3</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
9.027	6-CH <sub>3</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
9.028	H	2,3-Cl <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
9.029	H	2,4-Cl <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
9.030	H	2,5-Cl <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
9.031	H	2,6-Cl <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
9.032	H	3,4-Cl <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
9.033	H	3,5-Cl <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
9.034	H	2,3,4-Cl <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>2</sub>
9.035	H	2,3,5-Cl <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>2</sub>
9.036	H	2,3,6-Cl <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>2</sub>
9.037	H	2,4,5-Cl <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>2</sub>
9.038	H	2,4,6-Cl <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>2</sub>
9.039	H	3,4,5-Cl <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>2</sub>
9.040	H	2-Br-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
9.041	H	3-Br-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
9.042	H	4-Br-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
9.043	H	2,4-Br <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
9.044	H	2-Br, 4-F-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
9.045	H	2-Br, 4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
9.046	H	2-F, 4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
9.047	H	3-F, 4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
9.048	H	3-Cl, 5-F-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
9.049	H	2-Cl, 4-F-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
9.050	H	2-CN-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
9.051	H	3-CN-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
9.052	H	4-CN-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
9.053	H	3-CN, 4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
9.054	H	4-NO <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
9.055	H	4-H <sub>2</sub> N-C(-S)-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
9.056	H	2-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
9.057	H	3-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
9.058	H	4-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
9.059	H	2,4-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
9.060	H	2,5-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
9.061	H	2,5-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
9.062	H	2,6-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
9.063	H	3,4-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
9.064	H	3,5-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
9.065	H	2,4,6-(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>2</sub>
9.066	H	3,4,5-(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>2</sub>
9.067	H	2-CH <sub>3</sub> , 4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
9.068	H	2-Cl, 4-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
9.069	H	3-CH <sub>3</sub> , 4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>



No.	R <sup>1</sup> <sub>n</sub>	R <sup>2</sup>
9.070	H	3-Cl, 5-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
9.071	H	2-CN, 4-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
9.072	H	2-CH <sub>3</sub> , 4-CN-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
9.073	H	4-(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> )-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
9.074	H	4-[C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> ]-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
9.075	H	3-(C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> )-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
9.076	H	4-(C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> )-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
9.077	H	2-CF <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
9.078	H	3-CF <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
9.079	H	4-CF <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
9.080	H	3,5-(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
9.081	H	2-Cl, 4-CF <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
9.082	H	2-OCH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
9.083	H	3-OCH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
9.084	H	4-OCH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
9.085	H	2,4-(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
9.086	H	3,4-(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
9.087	H	2,5-(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
9.088	H	3,5-(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
9.089	H	3,4,5-(OCH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>2</sub>
9.090	H	2-CH <sub>3</sub> , 4-OCH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
9.091	H	2-Cl, 4-OCH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
9.092	H	4-OCF <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
9.093	H	2-OCHF <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
9.094	H	3-OCHF <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
9.095	H	4-OCHF <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
9.096	H	4-(OCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub> )-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
9.097	H	2-F, 4-OCHF <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
9.098	H	4-(OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> )-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
9.099	H	4-[OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> ]-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
9.100	H	3-(CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> )-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
9.101	H	4-(CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> )-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
9.102	H	4-[CO <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> ]-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
9.103	H	2,3-[O-CH <sub>2</sub> -O]-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
9.104	H	3,4-[O-CH <sub>2</sub> -O]-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
9.105	H	3,4-[O-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -O]-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
9.106	H	3,4-[O-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -O]-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
9.107	H	2,3-[(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> ]-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
9.108	H	3,4-[(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> ]-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
9.109	H	2,3-(CH=CH <sub>2</sub> -CH=CH)-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
9.110	H	3,4-(CH=CH-CH=CH)-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
9.111	H	CH <sub>3</sub>
9.112	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
9.113	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
9.114	H	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>

No.	R <sup>1</sup> <sub>n</sub>	R <sup>2</sup>
9.115	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
9.116	H	CHCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
9.117	H	CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
9.118	H	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>
9.119	H	环丙基
9.120	H	环己基
9.121	H	2-四氢呋喃基
9.122	H	3-四氢呋喃基
9.123	H	3-四氢噻吩基
9.124	H	2-1, 3-二氧戊环基
9.125	H	2-1, 3-二噁烷基
9.126	H	4-四氢吡喃基

表 A - 10



I.10

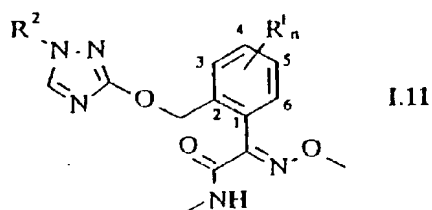
No.	R <sup>1</sup> <sub>n</sub>	R <sup>2</sup>
10.001	H	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>
10.002	3-Cl	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>
10.003	4-Cl	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>
10.004	6-Cl	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>
10.005	4-F	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>
10.006	4-OCH <sub>3</sub>	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>
10.007	3-CH <sub>3</sub>	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>
10.008	6-CH <sub>3</sub>	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>
10.009	H	2-F-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
10.010	H	3-F-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
10.011	H	4-F-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
10.012	H	2,3-F <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
10.013	H	2,4-F <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
10.014	H	2,5-F <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
10.015	H	2,6-F <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
10.016	H	3,4-F <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
10.017	H	3,5-F <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
10.018	H	2-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
10.019	H	3-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>

No.	R <sup>1</sup> <sub>n</sub>	R <sup>2</sup>
10.020	H	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
10.021	3-Cl	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
10.022	4-Cl	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
10.023	6-Cl	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
10.024	4-F	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
10.025	4-OCH <sub>3</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
10.026	3-CH <sub>3</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
10.027	6-CH <sub>3</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
10.028	H	2,3-Cl <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
10.029	H	2,4-Cl <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
10.030	H	2,5-Cl <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
10.031	H	2,6-Cl <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
10.032	H	3,4-Cl <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
10.033	H	3,5-Cl <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
10.034	H	2,3,4-Cl <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>2</sub>
10.035	H	2,3,5-Cl <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>2</sub>
10.036	H	2,3,6-Cl <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>2</sub>
10.037	H	2,4,5-Cl <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>2</sub>
10.038	H	2,4,6-Cl <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>2</sub>
10.039	H	3,4,5-Cl <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>2</sub>
10.040	H	2-Br-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
10.041	H	3-Br-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
10.042	H	4-Br-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
10.043	H	2,4-Br <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
10.044	H	2-Br, 4-F-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
10.045	H	2-Br, 4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
10.046	H	2-F, 4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
10.047	H	3-F, 4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
10.048	H	3-Cl, 5-F-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
10.049	H	2-Cl, 4-F-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
10.050	H	2-CN-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
10.051	H	3-CN-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
10.052	H	4-CN-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
10.053	H	3-CN, 4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
10.054	H	4-NO <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
10.055	H	4-H <sub>2</sub> N-C(=S)-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
10.056	H	2-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
10.057	H	3-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
10.058	H	4-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
10.059	H	2,4-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
10.060	H	2,5-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
10.061	H	2,5-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
10.062	H	2,6-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
10.063	H	3,4-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
10.064	H	3,5-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>

No.	R <sup>1</sup> <sub>n</sub>	R <sup>2</sup>
10.065	H	2, 4, 6-(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>2</sub>
10.066	H	3, 4, 5-(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>2</sub>
10.067	H	2-CH <sub>3</sub> , 4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
10.068	H	2-Cl, 4-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
10.069	H	3-CH <sub>3</sub> , 4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
10.070	H	3-Cl, 5-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
10.071	H	2-CN, 4-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
10.072	H	2-CH <sub>3</sub> , 4-CN-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
10.073	H	4-(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> )-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
10.074	H	4-[C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> ]-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
10.075	H	3-(C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> )-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
10.076	H	4-(C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> )-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
10.077	H	2-CF <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
10.078	H	3-CF <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
10.079	H	4-CF <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
10.080	H	3, 5-(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
10.081	H	2-Cl, 4-CF <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
10.082	H	2-OCH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
10.083	H	3-OCH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
10.084	H	4-OCH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
10.085	H	2, 4-(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
10.086	H	3, 4-(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
10.087	H	2, 5-(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
10.088	H	3, 5-(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
10.089	H	3, 4, 5-(OCH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>2</sub>
10.090	H	2-CH <sub>3</sub> , 4-OCH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
10.091	H	2-Cl, 4-OCH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
10.092	H	4-OCF <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
10.093	H	2-OCHF <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
10.094	H	3-OCHF <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
10.095	H	4-OCHF <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
10.096	H	4-(OCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub> )-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
10.097	H	2-F, 4-OCHF <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
10.098	H	4-(OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> )-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
10.099	H	4-[OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> ]-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
10.100	H	3-(CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> )-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
10.101	H	4-(CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> )-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
10.102	H	4-[CO <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> ]-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
10.103	H	2, 3-[O-CH <sub>2</sub> -O]-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
10.104	H	3, 4-[O-CH <sub>2</sub> -O]-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
10.105	H	3, 4-[O-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -O]-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
10.106	H	3, 4-[O-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -O]-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
10.107	H	2, 3-[(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> ]-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
10.108	H	3, 4-[(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> ]-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
10.109	H	2, 3-(CH=CH <sub>2</sub> -CH=CH)-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>

No.	R <sup>1</sup> <sub>n</sub>	R <sup>2</sup>
10.110	H	3,4-(CH=CH-CH=CH)-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
10.111	H	CH <sub>3</sub>
10.112	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
10.113	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
10.114	H	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
10.115	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
10.116	H	CHCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
10.117	H	CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
10.118	H	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>
10.119	H	环丙基
10.120	H	环己基
10.121	H	2-四氢呋喃基
10.122	H	3-四氢呋喃基
10.123	H	3-四氢噻吩基
10.124	H	2-1,3-二氧戊环基
10.125	H	2-1,3-二噁烷基
10.126	H	4-四氢吡喃基

表 A · J J



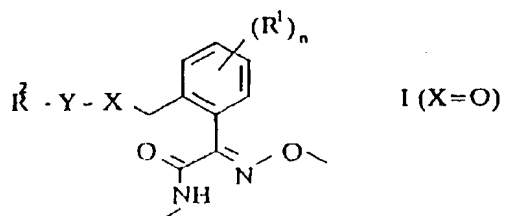
No.	R <sup>1</sup> <sub>n</sub>	R <sup>2</sup>
11.001	H	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>
11.002	3-Cl	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>
11.003	4-Cl	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>
11.004	6-Cl	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>
11.005	4-F	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>
11.006	4-OCH <sub>3</sub>	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>
11.007	3-CH <sub>3</sub>	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>
11.008	6-CH <sub>3</sub>	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>
11.009	H	2-F-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
11.010	H	3-F-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
11.011	H	4-F-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
11.012	H	2,3-F <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
11.013	H	2,4-F <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
11.014	H	2,5-F <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>

No.	R <sup>1</sup> <sub>n</sub>	R <sup>2</sup>
11.015	H	2,6-F <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
11.016	H	3,4-F <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
11.017	H	3,5-F <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
11.018	H	2-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
11.019	H	3-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
11.020	H	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
11.021	3-Cl	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
11.022	4-Cl	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
11.023	6-Cl	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
11.024	4-F	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
11.025	4-OCH <sub>3</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
11.026	3-CH <sub>3</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
11.027	6-CH <sub>3</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
11.028	H	2,3-Cl <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
11.029	H	2,4-Cl <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
11.030	H	2,5-Cl <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
11.031	H	2,6-Cl <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
11.032	H	3,4-Cl <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
11.033	H	3,5-Cl <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
11.034	H	2,3,4-Cl <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>2</sub>
11.035	H	2,3,5-Cl <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>2</sub>
11.036	H	2,3,6-Cl <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>2</sub>
11.037	H	2,4,5-Cl <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>2</sub>
11.038	H	2,4,6-Cl <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>2</sub>
11.039	H	3,4,5-Cl <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>2</sub>
11.040	H	2-Br-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
11.041	H	3-Br-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
11.042	H	4-Br-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
11.043	H	2,4-Br <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
11.044	H	2-Br, 4-F-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
11.045	H	2-Br, 4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
11.046	H	2-F, 4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
11.047	H	3-F, 4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
11.048	H	3-Cl, 5-F-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
11.049	H	2-Cl, 4-F-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
11.050	H	2-CN-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
11.051	H	3-CN-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
11.052	H	4-CN-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
11.053	H	3-CN, 4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
11.054	H	4-NO <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
11.055	H	4-H <sub>2</sub> N-C(=S)-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
11.056	H	2-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
11.057	H	3-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
11.058	H	4-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
11.059	H	2,4-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>

No.	R <sup>1</sup> <sub>n</sub>	R <sup>2</sup>
11.060	H	2,5-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
11.061	H	2,5-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
11.062	H	2,6-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
11.063	H	3,4-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
11.064	H	3,5-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
11.065	H	2,4,6-(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>2</sub>
11.066	H	3,4,5-(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>2</sub>
11.067	H	2-CH <sub>3</sub> , 4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
11.068	H	2-Cl, 4-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
11.069	H	3-CH <sub>3</sub> , 4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
11.070	H	3-Cl, 5-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
11.071	H	2-CN, 4-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
11.072	H	2-CH <sub>3</sub> , 4-CN-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
11.073	H	4-(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> )-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
11.074	H	4-[C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> ]-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
11.075	H	3-(C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> )-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
11.076	H	4-(C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> )-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
11.077	H	2-CF <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
11.078	H	3-CF <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
11.079	H	4-CF <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
11.080	H	3,5-(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
11.081	H	2-Cl, 4-CF <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
11.082	H	2-OCH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
11.083	H	3-OCH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
11.084	H	4-OCH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
11.085	H	2,4-(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
11.086	H	3,4-(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
11.087	H	2,5-(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
11.088	H	3,5-(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
11.089	H	3,4,5-(OCH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>2</sub>
11.090	H	2-CH <sub>3</sub> , 4-OCH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
11.091	H	2-Cl, 4-OCH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
11.092	H	4-OCF <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
11.093	H	2-OCHF <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
11.094	H	3-OCHF <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
11.095	H	4-OCHF <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
11.096	H	4-(OCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub> )-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
11.097	H	2-F, 4-OCHF <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
11.098	H	4-(OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> )-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
11.099	H	4-[OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> ]-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
11.100	H	3-(CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> )-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
11.101	H	4-(CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> )-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
11.102	H	4-[CO <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> ]-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
11.103	H	2,3-[O-CH <sub>2</sub> -O]-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
11.104	H	3,4-[O-CH <sub>2</sub> -O]-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>

No.	R <sup>1</sup> <sub>n</sub>	R <sup>2</sup>
11.105	H	3,4-[O-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -O]-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
11.106	H	3,4-[O-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -O]-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
11.107	H	2,3-[(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> ]-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
11.108	H	3,4-[(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> ]-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
11.109	H	2,3-(CH=CH <sub>2</sub> -CH=CH)-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
11.110	H	3,4-(CH=CH-CH=CH)-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
11.111	H	CH <sub>3</sub>
11.112	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
11.113	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
11.114	H	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
11.115	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
11.116	H	CHCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
11.117	H	CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
11.118	H	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>
11.119	H	环丙基
11.120	H	环己基
11.121	H	2-四氢呋喃基
11.122	H	3-四氢呋喃基
11.123	H	3-四氢噻吩基
11.124	H	2-1,3-二氧戊环基
11.125	H	2-1,3-二噁烷基
11.126	H	4-四氢吡喃基

表 A · 12





No.	R <sup>2</sup> --Y
12. 001	1— (2—吡啶基) 吡唑—4—基
12. 002	1— (3, 5—二—三氟甲基—2—吡啶基) 吡唑—4—基
12. 003	1— (5—氟—3—三氟甲基—2—吡啶基) 吡唑—4—基
12. 004	1— (6—三氟甲基—2—吡啶基) 吡唑—4—基
12. 005	1— (4—三氟甲基—6—甲基—2—吡啶基) 吡唑—4—基
12. 006	1— (1—乙基—2—吡啶基) 吡唑—4—基
12. 007	1— (3—吡啶基) 吡唑—4—基
12. 008	1— (6—甲基—3—吡啶基) 吡唑—4—基
12. 009	1— (4—吡啶基) 吡唑—4—基
12. 010	1— (2, 6—二甲基—4—吡啶基) 吡唑—4—基
12. 011	1— (6—甲基—3—噻嗪基) 吡唑—4—基
12. 012	1— (6—氟—3—噻嗪基) 吡唑—4—基
12. 013	1— (5—甲氧羰基—4—三氟甲基—2—嘧啶基—吡唑—4—基
12. 014	1— (4—三氟甲基—2—嘧啶基) —吡唑—4—基
12. 015	1— (5—氟—2—嘧啶基) 吡唑—4—基
12. 016	1— (6—三氟甲基—4—嘧啶基) 吡唑—4—基
12. 017	1) (5—乙基—2—嘧啶基) 吡唑—4—基
12. 018	1— (2—甲基—5—嘧啶基) 吡唑—4—基
12. 019	1— (5—甲基—2—吡嗪基) 吡唑—4—基
12. 020	1— (5—氟—2—吡嗪基) 吡唑—4—基
12. 021	1— (4—甲基—2—噻唑基) 吡唑—4—基

- 12.022 1—(5—甲基—3—噻唑基)吡唑—4—基
- 12.023 1—(5—环丙基—3—异噻唑)吡唑—4—基
- 12.024 1—(5—苯基—3—异噻唑)吡唑—4—基
- 12.025 4—甲基吡唑—1—基
- 12.026 4—氟吡唑—1—基
- 12.027 3, 5—二甲基吡唑—1—基
- 12.028 4—苯基吡唑—1—基
- 12.029 4—(3—甲基—5—异噻唑基)吡唑—1—基
- 12.030 4—(3—叔丁基—5—异噻唑基)吡唑—1—基
- 13.031 4—(3—苯基—5—异噻唑基)吡唑—1—基
- 12.032 4—(3—甲基—5—异噻唑基)噻唑—2—基
- 12.033 4—(3—异噻唑基—5—异噻唑基)噻唑—2—基
- 12.034 4—(2—甲基—4—噻唑基)噻唑—2—基
- 12.035 4—(2—己基—4—噻唑基)噻唑—2—基
- 12.036 2—(2—甲基—4—噻唑基)—5—甲基噻唑—4—基
- 12.037 4—(3—甲基—5—异噻唑基)噻唑—2—基
- 12.038 4—(3—甲基—4—异噻唑基)噻唑—2—基
- 12.039 4—(2—环丙基—4—噻唑基)噻唑—2—基
- 12.040 4—(1—甲氧亚氨基乙基)噻唑—2—基
- 12.041 4—(1—乙氧亚氨基乙基)噻唑—2—基
- 12.042 4—(1—丙—2—烯氧亚氨基乙基)噻唑—2—基
- 12.043 4—(1—叔丁氧亚氨基乙基)噻唑—2—基
- 12.044 4—(1—甲氧亚氨基丙基)噻唑—2—基
- 12.045 4—(1—甲氧亚氨基乙基)—5—甲基噻唑—2—基

12. 046      4—(1—丙—2—烯氧基亚氨基乙基)—5—甲基噻唑  
—2—基

例如,如下所述(实施例1—3),从易得的E—2—甲氧亚氨基—2—[(2—甲基苯氧甲基)苯基]乙酸甲酯(见EP 493 711),用甲胺氨解,然后用三氟化硼或溴化氢裂解,可制备起始化合物1A。

利用下列合成实施例中描述的步骤,对起始化合物进行适当修饰,以制备其它化合物1。这样得到的化合物连同物理数据列于下表中。

#### 实施例1

E—2—甲氧亚氨基—2—[(2—甲基苯氧甲基)苯基]—N—甲基乙酰胺

将250g E—2—甲氧亚氨基—2—[(2—甲基苯氧甲基)苯基]乙酸甲酯悬浮在1升40%的甲胺水溶液中,并于40℃加热4小时。冷却至室温后(20℃),吸滤滤出固体,用水洗涤数次,于50℃干燥。得到229.8g标题化合物,无色结晶。

M.p.: 109 - 112°C

<sup>1</sup>H-NMR (CDCl<sub>3</sub>, δ in ppm):

2.20 (s, 3H); 2.85 (d, 3H); 3.95 (s, 3H); 4.90 (s, 2H); 6.7 (NH); 6.8 - 7.6 (m, 8H)

#### 实施例2

E—2—甲氧亚氨基—2—[(2—氟甲基)苯基]—N—甲基乙酰胺

将2g 实施例1的E—2—甲氧亚氨基—2—[(2—甲基苯氧甲基)苯基]—N—甲基乙酰胺加到10℃的30ml无水二氟甲烷中。向此溶液中滴加9.4g三氟化硼(在正己烷中的1—摩尔溶液),加热回流1.5h,冷却至10℃,再加入9.4g三氟化硼,在室温(20℃)搅拌此混合物过夜。滴加8.2g甲醇后,在旋转蒸发器中浓缩。将残余物

溶于100ml 二氯甲烷中,用5%氢氧化钠溶液再用水漂洗此溶液。最后用硫酸钠干燥有机相。蒸去溶剂后,留下1.2g 油状标题化合物。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ ,  $\delta$  in ppm):  
2.95 (d, 3H); 3.90 (s, 3H); 4.45 (s, 2H); 6.8 (NH); 7.1 - 7.6 (m, 4H)

### 实施例 3

E-2-甲氧亚氨基-2-[(2-溴甲基) 苯基]-N-甲基乙酰胺

将10g 实施例1的E-2-甲氧亚氨基-2-[(2-甲基苯氧甲基) 苯基]-N-甲基乙酰胺加到50ml 无水二氯甲烷中。向此溶液中加入溴化氢,直到达饱和浓度(约9g HBr)。在室温下搅拌68h后,起始物完全反应。再加入50ml 二氯甲烷后,按实施例2那样处理此混合物。得到7.0g 油状标题化合物,静置后它完全结晶。

M.p.: 128 - 129°C

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ ,  $\delta$  in ppm):  
2.95 (d, 3H); 3.95 (s, 3H); 4.35 (s, 2H); 6.85 (NH); 7.1 - 7.5 (m, 4H)

### 实施例 4

E-2-甲氧亚氨基-2-[(2- [5- (4-氟苯基) 异噁唑-3-基] 氧基甲基) 苯基] 乙酸甲酯

将1.8g 3-羟基-5-(4-氟苯基) 异噁唑溶于10ml 二甲基甲酰胺中。向此溶液中加入1.6g 研细的碳酸钾和2.8g E-2-甲氧亚氨基-2-[(2-溴甲基) 苯基] 乙酸甲酯。于室温搅拌此反应混合物过夜,倾入50ml 水中处理。用甲基叔丁基醚萃取3次后,用硫酸钠干燥有机相。除去溶剂后,残余物用甲基叔丁基醚研制。吸滤

过滤后，得到 1.8g 标题化合物。

M.p.: 155 - 157°C

<sup>1</sup>H-NMR (CDCl<sub>3</sub>, δ in ppm):

3.85 (s, 3H); 4.06 (s, 3H); 5.2 (s, 2H); 6.1 (s, 1H); 7.2 - 7.7 (m, 8H)

#### 实施例 5

E-2-甲氧亚氨基-2-[(2-[5-(4-氟苯基)异噻唑-3-基]氧基甲基)苯基]-N-甲基乙酰胺

将 1.0g 实施例 4 的甲酯溶于 15ml 四氢呋喃中，用 40% 甲胺水溶液处理。在室温下搅拌此混合的过夜，浓缩，将残余物溶于 50ml 甲基叔丁基醚中。用水萃取有机相，用硫酸钠干燥，最后蒸发至干。得到 0.9g 标题化合物，无色固体。

M.p.: 195 - 198°C

<sup>1</sup>H-NMR (CDCl<sub>3</sub>, δ in ppm):

2.95 (d, 3H); 3.95 (s, 3H); 5.2 (s, 2H); 6.15 (s, 1H); 6.85 (NH); 7.2 - 7.8 (m, 8H)

#### 实施例 6

E-2-甲氧亚氨基-2-[(2-[5-(4-三氟甲基苯基)-1,3,4-噁二唑-2-基]硫基甲基)苯基]-N-甲基乙酰胺

将 1.35g 5-(4-三氟甲基苯基)-2-硫基-1,3,4-噁二唑和 1.43g 实施例 3 的溴甲基化合物溶于 30ml 丙酮中。加入 0.8g 研细的碳酸钾后，于室温搅拌混合物过夜。吸滤过滤固体，将滤液蒸发至干。残余物用正戊烷研制，吸滤过滤。得到 2.2 无色固体标题化合物。

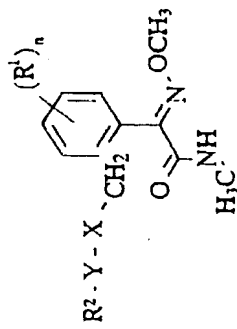
M.p.: 128 - 129°C  
<sup>1</sup>H-NMR (CDCl<sub>3</sub>, δ in ppm):  
[lacuna]

#### 实施例 7

E-2-甲氧亚氨基-2-[(2-[1-(4-氟-2-甲基)吡唑-4-基]氧基甲基)苯基]-N-甲基乙酰胺

将 1.05g 1-(4-氟-2-甲基苯基)-4-羟基吡唑加到 20ml 二氯甲烷中。加入 50mg 四正丁基碘化铵和 1.43g 实施例 3 的溴甲基化合物的二氯甲烷 (10ml) 溶液后, 用 20ml 10% 氢氧化钠开始反应。剧烈搅拌此两相系统, 直到溴甲基化合物完全转化。分离有机层, 用二氯甲烷萃取两次, 合并有机相, 用硫酸钠干燥。除去溶剂后得到的粗品溶于 70ml 异丙醚/丙酮 (5/2, V/V)。色谱分出不溶组分, 浓缩液体, 残余物在硅胶上层析 (甲苯/乙酸乙酯, 9:1 洗涤)。

表 1



No.	R <sup>1</sup> <sub>n</sub>	X	R <sup>2</sup> -Y	M.p. [°C]/IR [cm <sup>-1</sup> ]/ <sup>1</sup> H-NMR [ppm]
1	H	O	5-甲基-2-噻唑基	112 - 115
2	H	O	5-(4-氯苯基)-2-噻唑基	195 - 198
3	H	O	3-苯基-1,2,4-噻二唑-5-基	3230, 1652, 1588, 1462, 1351
5	H	S	5-(4-氯苯基)-1,3,4-噻二唑-2-基	186 - 188
6	H	S	5-(4-甲基苯基)-1,3,4-噻二唑-2-基	176 - 177
7	H	O	4-(4-氯苯基)-1,3-噻唑-2-基	118 - 120
8	H	O	4-(4-氯苯基)-1,3-噻唑-2-基	121 - 123
9	H	O	4-(2,4-二氯苯基)-1,3-噻唑-2-基	120 - 121
10	H	O	1-苯基-1,2,4-三唑-3-基	1667, 1545, 1329, 1069, 1038
11	H	O	1-苯基-1,2,4-三唑-3-基	1667, 1597, 1580, 1503, 1400, 1357, 1035
12	H	O	1-(4-氯苯基)-1,2,4-三唑-3-基	1667, 1514, 1403, 1358, 1227, 1033



No.	R <sup>1</sup> <sub>a</sub>	X	R <sup>2</sup> -Y	M.p. [°C]/IR [cm <sup>-1</sup> ]/ <sup>1</sup> H-NMR [ppm]
14	H	O	1-(4-三氟甲基苯基)吡唑-4-基	98 - 100
15	H	O	1-(4-氟基苯基)吡唑-4-基	130 - 135
16	H	O	1-(4-甲基苯基)吡唑-4-基	102 - 105
17	H	O	1-(4-氟基苯基)吡唑-4-基	111 - 114
18	H	O	1-(2,4-二氟基苯基)吡唑-4-基	104 - 106
19	H	O	5-三氟甲基异噻唑-3-基	97 - 98
20	H	O	5-苯基异噻唑-3-基	121 - 123
21	H	O	1-(6-氟-2-吡啶基)-1,2,4-三唑-3-基	153 - 155
22	H	O	1-(2-氟-4-甲基苯基)吡唑-4-基	
23	H	O	1-(2,4-二氟基苯基)吡唑-3-基	99 - 102
24	H	O	1-(4-氟基苯基)吡唑-3-基	110 - 122
25	H	O	1-(3-氟基苯基)吡唑-3-基	1670, 1596, 1547, 1475, 1036
26	H	O	1-(4-氟基苯基)吡唑-3-基	80 - 93
27	H	O	1-(4-甲基苯基)吡唑-3-基	3379, 1662, 1540, 1353, 1033
28	H	S	1-甲基咪唑-2-基	124 - 126
29	H	S	4-甲基-1,2,4-三唑-3-基	131 - 135
30	H	S	5-(4-三氟甲基苯基)-1,3,4-噁二唑-2-基	128 - 129
31	H	O	4-乙氧基吡唑-2-基	83 - 85
32	H	O	4-异丙基噻唑-2-基	73 - 74
33	H	O	4-异丁基噻唑-2-基	51 - 52

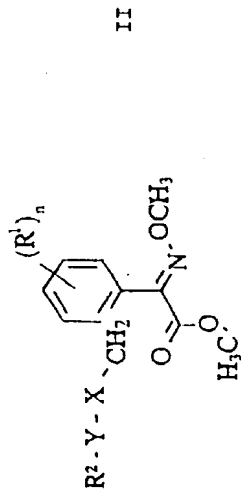
No.	R <sup>1</sup> <sub>n</sub>	X	R <sup>2</sup> -Y	M.p. [°C]/IR [cm <sup>-1</sup> ]/ <sup>1</sup> H-NMR [ppm]
34	H	O	4-苯基噻唑-2-基	128 - 130
35	H	O	4-(2-甲基苯基)噻唑-2-基	88 - 89
36	H	O	4-(3-甲基苯基)噻唑-2-基	91 - 92
37	H	O	4-(4-甲基苯基)噻唑-2-基	118 - 119
38	H	O	4-(2-甲氧基苯基)噻唑-2-基	1671, 1533, 1487, 1462, 1244, 1185, 1036
39	H	O	4-(3-甲氧基苯基)噻唑-2-基	113 - 114
40	H	O	4-(4-甲氧基苯基)噻唑-2-基	105 - 106
41	H	O	4-(3-溴苯基)噻唑-2-基	110 - 112
42	H	O	4-(4-溴苯基)噻唑-2-基	122 - 124
43	H	O	4-(3-三氟甲基苯基)噻唑-2-基	99 - 100
44	H	O	4-(4-三氟甲基苯基)噻唑-2-基	115 - 117
45	H	O	2-(4-氟苯基)-5-甲基噻唑-4-基	126
46	H	O	4-苯基噻唑-2-基	1670, 1619, 1602, 1348, 1036
47	H	O	5-环丙基异噻唑-3-基	3300, 1671, 1618, 1509, 1038
48	H	O	3-(4-氟苯基)-1,2,4-噻二唑-5-基	138 - 140
49	H	O	1-苯基吡唑-3-基	80 - 83
50	H	O	5-甲基-1-噻唑基噻唑-4-基	3340, 1668, 1598, 1503, 1409, 1036
51	H	O	3-(4-氟苯基)-1,2,4-噻二唑-5-基	105 - 110
52	3-Cl	O	1-(4-氟苯基)吡唑-3-基	144 - 147
53	3-Cl	O	1-(4-甲基苯基)吡唑-3-基	3350, 1670, 1543, 1357, 1039

No.	R <sup>1</sup> <sub>a</sub>	X	R <sup>2</sup> -Y	M.p. [°C]/IR [cm <sup>-1</sup> ]/ <sup>1</sup> H-NMR [ppm]
54	3-Cl	O	1-(4-氯苯基)吡啶-4-基	2.9 (3H); 3.9 (3H); 5.0 (2H); 6.8 (NH); 7.1 - 7.6 (9H)
55	H	O	4-(甲氧基乙基)噻唑-2-基	115 - 116
56	H	O	4-(乙氧基乙基)噻唑-2-基	65 - 67
57	H	O	5-(甲氧基乙基)-4-甲基噻唑-2-基	104 - 106
58	H	O	5-(乙氧基乙基)-4-甲基噻唑-2-基	3320, 1617, 1508, 1378, 1285, 1048
59	H	O	1-(n-氯苯基)-1,2,4-三唑-3-基	3310, 1660, 1551, 1504, 1333, 973
60	H	O	1-(4-氯苯基)-5-甲基-1,2,4-三唑-3-基	3330, 1670, 1541, 1350, 1036
61	H	O	1-甲基-5-三氟甲基吡啶-3-基	57 - 59
62	H	O	1-(2-氯苯基)吡啶-3-基	80 - 82
63	H	O	1-(2,4-二甲苯基)吡啶-3-基	3240, 1670, 1541, 1483, 1360, 1036
64	H	O	1-(4-氯苯基)-3-甲基吡啶-4-基	119 - 122
65	H	O	5-(5-甲基-1,2,4-噁二唑-3-基)异噁唑-3-基	113 - 115
66	H	O	5-(5-丙基-2,4-噁二唑-3-基)异噁唑-3-基	3325, 2936, 1659, 1529, 1346, 1039
67	H	O	5-(5-己基-1,2,4-噁二唑-3-基)异噁唑-3-基	3295, 2930, 1660, 1530, 1343, 1040
68	3-Cl	O	4-(4-氯苯基)-1,3-噻唑-2-基	68 - 71
69	3-Cl	O	4-(2,4-二氯苯基)-1,3-噻唑-2-基	128 - 130
70	3-Cl	O	1-(2,4-二氯苯基)吡啶-3-基	128 - 129

No.	R <sup>1</sup> <sub>a</sub>	X	R <sup>2</sup> -Y	M.P. [°C]/IR [cm <sup>-1</sup> ]/ <sup>1</sup> H-NMR [ppm]
71	3-Cl	O	1-(4-氯苯基)-1,2,4-三唑-3-基	171 - 173
72	H	O	1-(3,4-二氯苯基)吡唑-3-基	3330, 1670, 1547, 1474, 1358, 1036
73	H	O	1-(2,5-二氯苯基)吡唑-3-基	3310, 1670, 1546, 1490, 1471, 1435, 1035
74	H	O	1-(3,5-二氯苯基)吡唑-3-基	154 - 156
75	H	O	1-(4-氯-2-甲基苯基)吡唑-3-基	3320, 1669, 1543, 1479, 1350, 1034
76	H	O	1-(4-甲氧基苯基)吡唑-3-基	3330, 1670, 1542, 1517, 1360, 1034
77	H	O	1-(3-三氯甲基苯基)吡唑-3-基	114 - 116
78	H	O	1-(4-氯苯基)-δ-三氟甲基吡唑-3-基	3330, 1669, 1567, 1505, 1139
79	H	O	3-(4-氯苯基)异噻唑-δ-基	142 - 145
80	H	O	δ-氯基异噻唑-3-基	2.9 (3H); 4.0 (3H); 5.15 (2H); 6.3 (1H); 6.85 (1H); 7.2 - 7.6 (4H)
81	H	O	5-甲基-2-(吡唑-2-基)-1,3-噻唑-4-基	127 - 128
82	H	O	5-甲基-2-(吡唑-3-基)-1,3-噻唑-4-基	148 - 149
83	H	O	5-甲基-2-(吡唑-4-基)-1,3-噻唑-4-基	136 - 137
84	H	O	5-甲基-2-(咪唑-2-基)-1,3-噻唑-4-基	100 - 102
85	H	O	5-甲基-2-(噻吩-2-基)-1,3-噻唑-4-基	137 - 138
86	H	O	5-甲基-2-(3-甲基异噻唑-5-基)-1,3-噻唑-4-基	120 - 122

No.	R <sup>1</sup> <sub>a</sub>	X	R <sup>2</sup> -Y	M.p. [°C]/IR (cm <sup>-1</sup> )/ <sup>1</sup> H-NMR (ppm)
87	H	O	4-(3-甲基异噻唑-5-基)-噻唑-2-基	109 - 111
88	H	O	5-甲基-2-(2-甲基-1,3-噻唑-4-基)-1,3-噻唑-4-基	88 - 92
89	H	O	4-(2,4-二甲基-1,3-噻唑-5-基)-1,3-噻唑-4-基	129 - 130
90	H	O	5-甲基-2-(2-正庚基-1,3-噻唑-4-基)-1,3-噻唑-4-基	72 - 74
91	H	O	4-(2-正庚基-1,3-噻唑-4-基)-1,3-噻唑-2-基	64 - 66
92	H	O	1-(2-甲基苯基)吡唑-3-基	330, 1672, 1541, 1360, 1035
93	H	O	1-(3-甲基苯基)吡唑-3-基	3340, 1671, 1545, 1358, 1036
94	H	O	5-甲基-1-苯基吡唑-3-基	138 - 140

表 2



No.	R <sup>1</sup> <sub>n</sub>	X	R <sup>2</sup> -Y	M.p. [°C]/IR [cm <sup>-1</sup> ]/ <sup>1</sup> H-NMR [ppm]
1	H	O	5-甲基异噻唑-3-基	108 - 110
2	H	O	5-(4-氟苯基)异噻唑-3-基	155 - 157
3	H	O	3-苯基-1,2,4-噁唑-5-基	139 - 140
4	H	S	5-(4-氟苯基)-1,3,4-噁唑-2-基	103 - 105
5	H	S	5-(4-甲基苯基)-1,3,4-噁唑-2-基	135 - 136
6	H	O	4-(4-氟苯基)-1,3-噻唑-2-基	105 - 106
7	H	O	4-(4-氟苯基)-1,3-噻唑-2-基	109 - 110
8	H	O	4-(2,4-二氟苯基)-1,3-噻唑-2-基	136 - 137
9	H	O	1-苯基-1,2,4-三唑-3-基	88 - 90
10	H	O	1-苯基-1,2,4-三唑-4-基	1726, 1597, 1503, 1400, 1358, 1220, 1019
11	H	O	1-(4-氟苯基)吡唑-4-基	1727, 1583, 1514, 1224, 1070, 1021

No.	R <sup>1</sup> <sub>a</sub>	X	R <sup>2</sup> -Y	M.p. [°C]/IR [cm <sup>-1</sup> ]/ <sup>1</sup> H-NMR [ppm]
12	H	O	1-(4-三氟甲基苯基)吡唑-4-基	82 - 84
13	H	O	1-(4-氟苯基)吡唑-4-基	156 - 157
14	H	O	1-(4-甲基苯基)吡唑-4-基	105 - 107
15	H	O	1-(4-氯苯基)吡唑-4-基	86 - 90
16	H	O	1-(2,4-二氯苯基)吡唑-4-基	102 - 104
17	H	O	5-三氟甲基吡唑-3-基	90 - 93
18	H	O	5-苯基吡唑-3-基	95 - 97
19	H	O	1-(2,4-二氯苯基)吡唑-3-基	121
20	H	O	1-(4-氟苯基)吡唑-3-基	112 - 113
21	H	O	1-(3-氟苯基)吡唑-3-基	80 - 84
22	H	O	1-(4-氯苯基)吡唑-3-基	105 - 107
23	H	O	1-(4-甲基苯基)吡唑-3-基	110 - 111
24	H	S	1-甲基咪唑-2-基	104 - 108
25	H	S	4-甲基-1,2,4-三唑-3-基	144
26	H	O	4-乙酰基咪唑-2-基	110 - 112
27	H	O	4-异丙基咪唑-2-基	1726, 1515, 1322, 1253, 1068
28	H	O	4-异丁基咪唑-2-基	1729, 1533, 1437, 1314, 1227, 1069
29	H	O	4-(2-甲基苯基)噻唑-2-基	99 - 100
30	H	O	4-(3-甲基苯基)噻唑-2-基	79 - 80
31	H	O	4-(4-甲基苯基)噻唑-2-基	121 - 122

No.	R <sup>1</sup> <sub>n</sub>	X	R <sup>2</sup> -Y	M.p. [°C]/IR [cm <sup>-1</sup> ]/ <sup>1</sup> H-NMR [ppm]
32	H	O	4-(2-甲氧苄基)噻唑-2-基	111 - 113
33	H	O	4-(3-甲氧苄基)噻唑-2-基	78 - 79
34	H	O	4-(4-甲氧苄基)噻唑-2-基	132 - 133
35	H	O	4-(3-苄基)噻唑-2-基	91 - 94
36	H	O	4-(4-苄基)噻唑-2-基	123 - 125
37	H	O	4-(3-三氟甲氧苄基)噻唑-2-基	85 - 86
38	H	O	4-(4-三氟甲氧苄基)噻唑-2-基	94 - 95
39	H	O	2-(4-氟苄基)-5-甲氧苄基-4-基	105 - 106
40	H	O	5-环丙基异噻唑-3-基	103 - 106
41	H	O	3-(4-氟苄基)-1,2,4-噻唑-5-基	139 - 140
42	H	O	1-苄基吡唑-3-基	80 - 83
43	H	O	5-甲基-1-苄基吡唑-4-基	1726, 1598, 1503, 1361, 1188, 1069
44	H	O	3-(4-氟苄基)-1,2,4-噻唑-5-基	153 - 155
45	3-Cl	O	1-(4-氟苄基)吡唑-3-基	100 - 104
46	3-Cl	O	1-(4-甲氧苄基)吡唑-3-基	141 - 146
47	H	O	4-(甲氧亚氧乙基)噻唑-2-基	105 - 106
48	H	O	4-(乙氧亚氧乙基)噻唑-2-基	92 - 93
49	H	O	5-(甲氧亚氧乙基)-4-甲氧苄基-2-基	75 - 76
50	H	O	5-(乙氧亚氧乙基)-4-甲氧苄基-2-基	95 - 97
51	H	O	1-(n-氟苄基)-1,2,4-三唑-3-基	95



No.	R <sup>1</sup> <sub>a</sub>	X	R <sup>2</sup> -Y	M.p. [°C]/IR (cm <sup>-1</sup> )/ <sup>1</sup> H-NMR (ppm)
52	H	O	1-(4-氯苯基)-5-甲基-1,2,4-三唑-3-基	1729, 1539, 1434, 1350, 1018
53	H	O	1-甲基-5-三氟甲基-1,2,4-三唑-3-基	50 - 52
54	H	O	1-(2-氯苯基)吡唑-3-基	85 - 87
55	H	O	1-(2,4-二甲苯基)吡唑-3-基	95 - 100
56	H	O	1-(4-氯苯基)-3-甲基-1,2,4-三唑-3-基	109 - 114
57	H	O	5-(5-甲基-1,2,4-噁二唑-3-基)异噁唑-3-基	128 - 131
58	H	O	5-(5-丙基-1,2,4-噁二唑-3-基)异噁唑-3-基	73 - 74
59	H	O	5-(5-己基-1,2,4-噁二唑-3-基)异噁唑-3-基	1728, 1526, 1439, 1359, 1221, 1069
60	H	O	1-甲基-3-苯基-1,2,4-三唑-5-基	110
61	H	O	1-(3,5-二氯苯基)-1,2,4-三唑-3-基	157 - 160
62	H	O	5-乙基-1-苯基-1,2,4-三唑-3-基	88 - 91
63	H	O	1-(2,4-二氯苯基)-1,2,4-三唑-3-基	129 - 131
64	H	O	1-(2,6-二氯苯基)吡唑-3-基	128 - 130
65	3-Cl	O	4-(4-氯苯基)-1,3-噁唑-2-基	154 - 155
66	3-Cl	O	4-(2,4-二氯苯基)-1,3-噁唑-2-基	155 - 158
67	3-Cl	O	1-(2,4-二氯苯基)吡唑-3-基	133 - 135
68	3-Cl	O	1-(4-氯苯基)-1,2,4-三唑-3-基	130 - 131
69	H	O	1-(3,4-二氯苯基)吡唑-3-基	95 - 97
70	H	O	1-(2,5-二氯苯基)吡唑-3-基	90 - 93
71	H	O	1-(3,5-二氯苯基)吡唑-3-基	130 - 132

No.	R <sup>1</sup> <sub>n</sub>	X	R <sup>2</sup> -Y	M.p. [°C]/IR [cm <sup>-1</sup> ]/ <sup>1</sup> H-NMR [ppm]
72	H	O	1-(4-氯-2-甲基苯基)吡唑-3-基	113 - 155
73	H	O	1-(4-甲基苯基)吡唑-3-基	102 - 105
74	H	O	1-(3-三氟甲基苯基)吡唑-3-基	109 - 111
75	H	O	3-(4-氯苯基)异噁唑-5-基	113 - 114
76	H	O	5-氯苯异噁唑-3-基	105 - 107
77	H	O	5-甲基-2-(吡啶-2-基)-1,3-噁唑-4-基	105 - 107
78	H	O	5-甲基-2-(吡啶-3-基)-1,3-噁唑-4-基	97 - 98
79	H	O	5-甲基-2-(吡啶-4-基)-1,3-噁唑-4-基	146 - 147
80	H	O	5-甲基-2-(咪唑-2-基)-1,3-噁唑-4-基	92 - 93
81	H	O	5-甲基-2-(噁吩-2-基)-1,3-噁唑-4-基	109 - 110
82	H	O	5-甲基-2-(3-甲基-异噁唑-5-基)-1,3-噁唑-4-基	111 - 113
83	H	O	4-(3-甲基异噁唑-5-基)-1,3-噁唑-2-基	98 - 100
84	H	O	5-甲基-2-(2-甲基-1,3-噁唑-4-基)-1,3-噁唑-4-基	96 - 97
95	H	O	4-(2,4-二甲基-1,3-噁唑-5-基)-1,3-噁唑-2-基	117 - 118
86	H	O	5-甲基-2-(2-正庚基-1,3-噁唑-4-基)-1,3-噁唑-4-基	73 - 75
87	H	O	4-(2-正庚基-1,3-噁唑-4-基)-1,3-噁唑-2-基	73 - 75
88	H	O	5-甲基-2-苯基-1,3-噁唑-2-基	108 - 110
89	H	O	5-甲基-2-苯基-1,3-噁唑-3-基	77 - 78

No.	R <sup>1</sup> <sub>2</sub>	X	R <sup>2</sup> -Y	M.p. [°C]/IR (cm <sup>-1</sup> )/ <sup>1</sup> H-NMR (ppm)
90	H	O	5-氨基甲酰异噻唑-3-基	142 - 145
91	H	O	5-(1,2,4-噁唑-3-基)异噻唑-3-基	122 - 123
92	H	O	4-甲氧羰基-1-苯基吡唑-3-基	90 - 93
93	H	O	1-(2-甲氧羰基)吡唑-3-基	81 - 85
94	H	O	5-(5-硫基-1,3,4-噁二唑-2-基)异噻唑-3-基	3348, 1730, 1556, 1478, 1368, 1071
95	H	O	5-(5-硫基-1,3,4-噁二唑-2-基)异噻唑-3-基	3260, 1816, 1803, 1780, 1734, 1559, 1502, 1353, 1066

化合物 I 适于作为杀真菌剂。

化合物 I 的特征是对广谱植物致病真菌的显著活性，特别是对子囊菌纲和担子菌纲。某些情形下它们具有系统活性，可用作叶和土壤杀真菌剂。

它们对控制真菌在各种作物和其种子上的繁殖特别重要，所述作物如为小麦、黑麦、麦、燕麦、稻、玉米、草地、棉花、大豆、咖啡、甘蔗、葡萄、水果和装饰性植物和蔬菜植物，如黄瓜、菜豆和葫芦科。

它们特别适于控制下列植物疾病：

谷物上的禾白粉菌，葫芦科上的二孢白粉菌和单丝壳，苹果上的白叉丝单囊壳，藤本植物上的葡萄钩丝壳，谷物上的柄锈菌，棉花和草地上的丝核菌，谷物和甘蔗上的黑粉菌，苹果上的苹果黑星菌，谷物上的长蠕孢，小麦上的颖壳壳针孢，草莓和藤本植物上的灰葡萄孢，落花生上的落花生尾孢，小麦、大麦上的似菱毛壳假尾孢，稻上的 *pyricularia oryzae*，番茄和马铃薯上的致病疫霉，各种植物上的镰孢和轮枝孢，藤本植物上的葡萄生单轴霉，蔬菜和水果上的链格孢。

这样施用化合物 I：以杀真菌有效量的活性化合物处理真菌或要保护防止真菌袭击的植物、种子、材料或土壤。在这些材料、植物或种子被真菌感染前或后施用。

可以将它们转化为常规剂型，如溶液、乳液、悬液、粉剂、粉末、糊剂和粒剂。施用形式取决于具体用途；但无论如何应保证环丙烷羧酸的邻位取代的苯酯精细而均一地分散。用已知方法制备制剂，如将活性化合物与溶剂和/或载体混合，需要时使用乳化剂和分

散剂,当用水作为稀释剂时还可能使用其它有机溶剂作为辅助溶剂。用于此目的辅料主要有:溶剂如芳烃(如二甲苯)、卤代芳烃(如氯苯)、石蜡(如矿物细馏份)、醇(如甲醇、丁醇)、酮(如环己酮)、胺(如甲醇胺、二甲基甲酰胺)和水;载体如研磨后的天然矿物(如高岭土、粘土、滑石、白垩)和经研磨的合成矿物(如高分散硅酸、硅酸盐);乳化剂如非离子性和阴离子乳化剂(如聚氧乙烯脂肪醇醚、烷基磺酸盐和芳磺酸盐),及分散剂如木素—亚硫酸盐废液和甲基纤维素。

杀真菌混合物一般含有0.1—95%,优选0.5—90%(重量)的活性化合物。

根据所要使用的类型,施用率为0.02—3kg化合物/公顷。

在种子处理中,每公斤种子一般需要0.001—50g,优选0.01—10g活性化合物。

本发明组合物还可以作为杀真菌剂与其它活性化合物存在于施用形式中,例如与除草剂、杀虫剂、生长调节剂、杀真菌剂一起或与肥料一起使用。

当与杀真菌剂混合时,许多情况下杀真菌谱得以扩大。

与本发明化合物一起施用的下列杀真菌剂应只是对结合可能性的说明,而不是限制:

硫,二硫代氨基甲酸盐和它们的衍生物,如二甲基二硫代氨基甲酸铁、二甲基二硫代氨基甲酸锌、亚乙基双二硫代氨基甲酸锌、亚乙基双二硫代氨基甲酸锰、乙二胺双二硫代氨基甲酸锰锌、二硫化四甲基秋兰姆、(N,N—亚乙基双二硫代氨基甲酸)锌的氨复合物、(N,N'—亚丙基双二硫代氨基甲酸)锌的氨合物、(N,N'—亚丙

基双二硫代氨基甲酸) 锌、N, N'—聚丙烯双(硫代氨基甲酰基) 二硫化物;

硝基衍生物, 如二硝基(1-甲基庚基) 苯基巴豆酸酯、2-仲丁基—4, 6-二硝基苯基 3, 3-二甲基丙烯酸酯、2-仲丁基—4, 6-二硝基苯基异丙基碳酸酯、5-硝基间苯二酸二异丙酯;

杂环物质, 如 2-十七烷基—2-咪唑啉乙酸盐、2, 4-二氯—6-(邻氯苯胺基)—S—三嗪、邻苯二甲酰亚氨基硫代膦酸 0, 0-二乙酯、5-氨基—1-[二(二甲氨基) 氧膦基]—3-苯基—1, 2, 4-三唑、2, 3-二氯基—1, 4-二硫代萘醌、2-硫代—1, 3-二硫杂环戊二烯并[4, 5-b] 噻恶啉、1-(丁基氨基甲酰基)—2-苯并咪唑氨基甲酸甲酯、2-甲氧羰基氨基苯并咪唑、2-(呋喃—2-基) 苯并咪唑、2-(噻唑—4-基) 苯并咪唑、N-(1, 1, 2, 2-四氯乙基硫基) 四氯邻苯二甲酰亚胺、N-三氯甲基硫基四氯邻苯二甲酰亚胺、N-三氯甲基硫基邻苯二甲酰亚胺;

N-二氯氧甲硫基—N', N'-二甲基—N-苯基 fulfadimide、5-乙氧基—3-三氯甲基—1, 2, 3-噻二唑、2-氧硫基甲硫基苯并噻唑、1, 4-二氯—2, 5-二甲氧基苯、4-(2-氯苯基亚胂基)—3-甲基—5-异噻唑酮、2-硫代吡啶—1-氧化物、8-羟基喹啉或其铜盐、2, 3-二氯—5-苯胺基羰基—6-甲基—1, 4-氧硫杂环己二烯、2, 3-二氯—5-苯胺基羰基—6-甲基—1, 4-氧硫杂环己二烯—4, 4-二氧化物、2-甲基—5, 6-二氯—4H-吡喃—3-甲酰苯胺、2-甲基呋喃—3-甲酰苯胺、2, 5-二甲基呋喃—3-甲酰苯胺、2, 4, 5-三甲基呋喃—3-甲酰苯胺、N-环己基—2, 5-二甲基呋喃—3-甲酰胺、N-环己基—N-甲氧基—2, 5-二甲基呋

喃—3—甲酰胺 2—甲基苯甲酰苯胺、2—碘苯甲酰苯胺、N—甲酰  
 —N—吗啉—2, 2, 2—三氟乙基乙缩醛、哌嗪—1, 4—二基二(1—  
 (2, 2, 2—三氟乙基) 甲酰胺、1—(3, 4—二氟苯胺基)—1—甲  
 酰氨基—2, 2, 2—三氟乙烷、2, 6—二甲基—N—十三烷基吗啉或  
 其盐、2, 6—二甲基—N—环十二烷基吗啉或其盐、N—[3—(对叔  
 丁基苯基)—2—甲基丙基]—顺—2, 6—二基吗啉、N—[3—(对  
 叔丁基苯基)—2—甲基丙基] 哌啶、1—[2—(2, 4—二氟苯  
 基)—4—乙基—1, 3—二氧戊环—2—基—乙基]—1H—1, 2, 4—  
 三唑、1—[2—(1, 4—二氟苯基)—4—正丙基—1, 3—二氧戊环  
 —2—基乙基]—1H—1, 2, 4—三唑、N—[(正丙基)—N—(2,  
 4, 6—三氟苯氧基乙基)—N'—咪唑基脲、1—(4—氟苯氧基)—  
 3, 3—二甲基—1—(1H—1, 2, 4—三唑—1—基)—2—丁酮、1—  
 (4—氟苯氧基)—3, 3—二甲基—1—(1H—1, 2, 4—三唑—1—  
 基)—2—丁醇、 $\alpha$ —(2—氟苯基)—2—(4—氟苯基)—5—噻唑甲  
 醇、5—丁基—2—甲氨基—4—羟基—6—甲基嘧啶、二(对氟苯  
 基)—3—吡啶甲醇、1, 2—二(3—乙氧羰基—2—硫脲基) 苯、1,  
 2—二(3—甲氧羰基—2—硫脲基) 苯, 还有各种杀真菌剂, 如十二  
 烷基胍乙酸盐、3—[3—(3, 5—二甲基—2—氧环己基)—2—羟  
 基乙基] 戊二酰亚胺、六氟苯、DL—甲基—N—(2, 6—二甲基苯  
 基)—N—2—呋喃甲酰基丙氨酸酯、DL—N—(2, 6—二甲基苯  
 基)—N—(2'—甲氧乙酰) 丙氨酸甲酯、N—(2, 6—二甲基苯  
 基)—N—氧乙酰—D, L—2—氨基丁内酯、DL—N—(2, 6—二甲  
 基苯基)—N—(苯乙酰) 丙氨酸甲酯、5—甲基—5—乙烯基—3—  
 (3, 5—二氟苯基)—2, 4—二氧代—1, 3—噁唑烷、3—[3, 5—

二氟苯基 (—5—甲基—5—甲氧甲基) —1, 3—噁唑烷—2, 4—二酮、3—(3, 5—二氟苯基) —1—异丙基氨基甲酰基海因、N—(3, 5—二氟苯基) —1, 2—二甲基环丙烷—1, 2—二甲酰胺、2—肼基—[N—乙基氨基羰基—2—甲氧亚氨基] 乙酰胺、1—[2—(2, 4—二氟苯基) 戊基] —1H—1, 2, 4—三唑、2, 4—二氟— $\alpha$ —(1H—1, 2, 4—三唑基—1—甲基) 二苯甲基醇、N—(3—氟—2, 6—二硝基—4—三氟甲基苯基)—5—三氟甲基—3—氟—2—氨基吡啶、1—((2—(4—氟苯基) 甲基甲硅烷基) 甲基)—1H—1, 2, 4—三唑。

特别优选下列活性化合物作为混合物组分：

1—(2—氟基—2—甲氧亚氨基乙酰)—3—乙基脲(俗名: cymoxanil US—A 3, 957, 847); 亚乙基双(二硫代氨基甲酸锌) 配合锰(俗名: mancozeb, US—A 3, 379, 610); 亚乙基双(二硫代氨基甲酸) 锰(俗名: maneb, US—A 2, 504, 404); 亚乙基双(二硫代氨基甲酸) 锌氨合物(曾用俗名: metiram, US—A 3, 248, 400); 亚乙基双(二硫代氨基甲酸) 锌(俗名: Zineb, US—A 2, 457, 674), (11) —顺—4—[3—(4—叔丁基苯基)—2—甲基丙基] —2, 6—二甲基吗啉(俗名: fenpropimorph, US—A 4, 202, 894); (RS) —1—[3—(4—叔丁基苯基)—2—甲基丙基] 哌啶(俗名: fenpropidin, US—A 4, 202, 894); 2, 6—二甲基—4—[C<sub>11-14</sub>—烷基] 吗啉(俗名: tridemorph, DE—A 11 64 152); 1—[(2RS, 4RS; 2RS, 4SR)—4—溴—2—(2, 4—二氟苯基) 四氢呋喃基] —1H—1, 2, 4—三唑[俗名: bromuconazole, Proc. Br. Crop. Prot. Conf. Pests Dis., 5—6, (1990) 439]; 2—(4—氟苯基)—3—环丙基—1—(1H—1, 2, 4—三唑—1—基] 丁—2—醇(俗名: cyproconazole, US



—A 4, 664, 696); (H) —4—氟—4—[4—甲基—2—(1H—1, 2, 4—三唑—1—基甲基)—1, 3—二氧戊环—2—基] 苯基 4—氟苯基醚 (俗名 difenoconazole, GB—A 2, 098, 007); (E) —(R, S)—1—(2, 4—二氟苯基)—4, 4—二甲基—2—(1H—1, 2, 4—三唑—1—基) 戊—1—烯—3—醇 (俗名: diniconazole, CAS RN (83657—24—3]); (Z) —2—(1H—1, 2, 4—三唑—1—基甲基)—2—(4—氟苯基)—3—(2—氟苯基) 环氧乙烷 (俗名: epoxyconazole, EP—A 196 038); 4—(4—氟苯基)—2—苯基—2—(1H—1, 2, 4—三唑基甲基) 丁腈 (俗名: fenbuconazole, Ep—A—251 775); 3—(2, 4—二氟苯基)—6—氟—2—(1H—1, 2, 4—三唑—1—基) 喹唑啉—4 (3H) 酮 [俗名: fluquinconazole, Proc. Br. Crop Prot. Conf. Pests Dis., 5—3, (1992) 411]; 双 (4—氟苯基) (甲基) (1H—1, 2, 4—三唑—1—基甲基) 甲硅烷 [俗名: flusilazole, Proc. Br. Crop Prot. Conf. Pests Dis., 1, (1984) 413]; (R, S)—2—(2, 4—二氟苯基)—1—(1H—1, 2, 4—三唑—1—基) 己—2—醇 (俗名: hexaconazole, CAS RN [79983—71—4]); (1RS, 5RS; 1RS, 5SR)—5—(4—氟苯基)—2, 2—二甲基—1—(1H—1, 2, 4—三唑—1—基甲基) 环戊醇 [俗名: metconazole, Proc. Br. Crop Prot. Conf. Pests Dis., 5—4, (1992) 419]; N—丙基—N—[2—(2, 4, 6—三氟苯氧基) 乙基] 咪唑—1—甲酰胺 (俗名: prochloraz, US—A 3, 991, 071); (±)—1—[2—(2, 4—二氟苯基)—4—丙基—1, 3—二氧戊环—2—基甲基)—1H—1, 2, 4—三唑 (俗名: propiconazole, GB—A 1, 522, 657); (R, S)—1—(4—氟苯基)—4, 4—二甲基—3—(1H—1, 2, 4—三唑—1—基甲基) 戊—3—醇 (俗名: tebuconazole,

US-A 4, 723, 984); (士) —2— (2, 4—二氯苯基) —3— (1H—1, 2, 4—三唑—1—基 O 丙基, 1, 1, 2, 2—四氯乙基醚[俗名: tetraconazole, Proc. Br. Crop Prot. Conf. Pests Dis., 1, (1988) 49]; (E) —1— [(1— [4—氯—2— (三氯甲基) 苯基] 亚氨基) —2—丙氧乙基] —1H—咪唑 (俗名: triflumizole, JP —A 79/119, 462); (RS) —2, 4' —二氟—2— (1H—1, 2, 4—三唑—1—基甲基) 二苯甲基醇 (俗名: flutriafol, CAS RN [76674—21—0]; 1— [2— (2, 5—二甲基苯氧基) 苯基] —1—甲氧亚氨基—N—甲基乙酰胺 (EP—A 477 631); 1— [2— (2—甲基苯氧基) 苯基] —1—甲氧亚氨基乙酸甲酯 (EP—A 253 213); 1— {2— [6— (3—氯基苯氧基) 嘧啶—4—基氧基] 苯基} —1—甲氧亚氨基乙酸甲酯 (EPA 382 375); N— (三氯甲基) 环己—4—烯—1, 2—二碳酸亚胺 (俗名: captan, US—A 2, 553, 770); N— (三氯甲基) 邻苯二甲酰亚胺 (俗名: folpet US—A 2, 553, 770); 4, 6—二甲基—2—苯基氨基嘧啶 (俗名: pyrimethanil, DD—A 151 404); =4—甲基—2—苯基氨基—6—丙炔基嘧啶 (俗名: mepanipyrim, EP—A 224 339); 4—环丙基—6—甲基—2—苯基氨基嘧啶 (EP—A 310 550)。

式 I 化合物还适于有效地控制昆虫纲、蛛形纲和线虫纲的害虫。它们还在植物保护、和卫生、储存产品保护和兽医领域中用作杀虫剂。

有害昆虫包括蝴蝶类 (鳞翅目)、例如、小地老虎、黄地老虎、棉叶夜蛾、梨豆夜蛾、苹果银蛾、Y 纹夜蛾、松尺蠖、murinana 黄卷蛾、网状卷蛾、Cheimatobia brumata, 柞色卷蛾、西柞色卷蛾、粘虫、苹果小卷蛾、欧洲松毛虫、黄瓜绢野螟、西南玉米秆草螟、埃及金

铜箔南美玉米苗斑螟、*Eupoecilia ambiguella*, 欧洲松梢小卷蛾、粒肤地虎、大蜡螟、李小食心虫、梨小食心虫、棉铃虫、烟芽夜蛾、谷实夜蛾、菜心野螟、*Hibernia defoliaria*、美国白蛾、苹果巢蛾、茄卷麦蛾、东方铁杉尺蠖、甜菜夜蛾、咖啡一点潜蛾、旋纹潜蛾、革细蛾、花翅小卷蛾、甜菜网野螟、舞毒蛾、模毒蛾、桃潜蛾、黄褐天幕毛虫、甘蓝夜蛾、*pseudotsugata* 十毒蛾、玉米螟、松夜蛾、*Pectinophora gossypiella*、杂色地老虎、圆掌舟蛾、马铃薯麦蛾、桔潜蛾、大菜粉蝶、苜蓿绿夜蛾、菜蛾、大豆尺夜蛾、*Phyaclonia frustrana*, *Scrobipalpula absoluta*, 麦蛾、葡萄长须卷蛾、草地夜蛾、海灰翅夜蛾、*litura* 灰翅夜蛾、松异舟蛾、柝绿卷蛾、粉纹夜蛾、纵线小卷蛾。

甲虫类(鞘翅目), 例如, 梨窄吉丁、直条叩头虫、暗色叩头虫、马铃薯鳃角金龟、异形方胸材小蠹、墨西哥棉铃象、梨花象、甜菜隐食甲、纵坑切梢小蠹、*undata* 埋葬虫, 蚕豆象、豌豆象、扁豆象、榛绿卷象、甜菜大龟甲、菜豆萤叶甲、白菜籽龟象、*napi* 瘦象甲、甜菜胫跳甲、烟草叩头虫、石刁柏负泥虫、长角叶甲、*12-punctata* 条叶甲、玉米根叶甲、墨西哥大豆瓢虫、烟草跳甲、棉籽灰象、松大根颈象、埃及苜蓿叶象、紫苜蓿叶象、云杉八齿小蠹、烟草负泥虫、黑角负泥虫、马铃薯叶甲、甜菜叩头虫、稻根象、*communis* 叩头虫、油菜花露尾甲、东方五月鳃角金龟、西方五月鳃角金龟、*Onlema oryzae*、黑葡萄耳象、*ovatus* 斑额象虫、辣根猿叶甲、*Chrysoccephala* 跳甲、金龟属、庭园叶丽蛱、大豆淡足跳甲、黄曲条跳甲、日本弧丽蛱、直条根瘤象、谷象。

双翅目昆虫(双翅目), 例如, 埃及伊蚊、刺扰伊蚊、墨西哥按实蝇、五斑按蚊、地中海蜡实蝇、蛆症金蝇、*hominivorax* 金蝇、*macel-*

laria 金蝇、高粱瘦蚊、噬人瘤蝇、尖音库蚊、瓜大实蝇、橄榄大实蝇、油菜英叶瘦蚊、夏厕蝇、肠胃蝇、刺舌蝇、西方角蝇、鞍瘦瘦蚊、玉米种蝇、纹皮蝇、美甜瓜斑潜蝇、trifolii 斑潜蝇、caprina 绿蝇、铜绿蝇、丝光绿蝇、Lycoria pectoralis, 小麦瘦蚊、家蝇、厩腐蝇、羊狂蝇、瑞典麦秆蝇、藜象蝇、antiqua 草种蝇、brassicae 草种蝇、coarctata 草种蝇、樱桃绕实蝇、草绕实蝇、牛虻、oleracea 大蚊、欧洲大蚊。

蓟马 (缨翅目), 例如, 烟褐花蓟马、西花蓟马、麦花蓟马、桔实硬蓟马、稻蓟马、棕榈蓟马、烟蓟马。

膜翅昆虫 (膜翅目), 例如, 菜叶蜂、热带切叶蚁、切叶蚁、得州切叶蚁、李小叶蜂、草实蜂、法老蚁、火蚁、红外来火蚁。

象虫目 (半翅目—异翅亚目), 例如, 拟缘蝽、美洲毛谷长蝽、黑斑烟盲蝽、棉红蝽、intermedius 棉红蝽、麦扁盾蝽、棉蝽、棉铃喙缘蝽、美国牧草盲蝽、稻绿蝽、方背皮蝽、insularis 稻蝽、perditor 扁蝽。

吸吮植物的昆虫 (半翅目), 例如, onobrychis 无网蚜、落叶松球蚜、鼠李马铃薯蚜、豆卫矛蚜、苹果蚜、接骨木蚜、飞廉短尾蚜、甘蓝蚜、Cerosipha gossypii、nordmannianae 椎球蚜、云杉椎球蚜、radicoid 西圆尾蚜、Dysaulacorthum pseudosolani、蚕豆微叶蝉、麦长管蚜、马铃薯长管蚜、蒿蓣长管蚜、巢菜修尾蚜、麦无网蚜、桃蚜、樱桃瘤蚜、褐飞虱、柄瘦棉蚜、蔗飞虱、忽布疣蚜、苹木虱、梨木虱、冬葱缢瘤蚜、玉米蚜、梨砧草蚜、苹红扎圆尾蚜、麦二叉蚜、Schizoneura lanuginosa、温室粉虱、葡萄根瘤蚜。

白蚁目 (白蚁等翅目), 例如: Calotermes flavicollis、欧美散白蚁、lucifugus 散白蚁、natalensis 白蚁。

直翅科的昆虫(直翅目),例如,家蟋、东方蟥、德国蟥、欧洲球螋、欧洲螻蛄、飞蝗、双带黑蝗、赤胫黑蝗、墨西哥黑蝗、血黑蝗、墨西哥黑蝗、红蝗、美洲大蟥、南美沙漠蝗、peregrina 沙漠蝗、*Stauronotus maroccanus*、温室沙蚕。

蜘蛛纲,例如蜘蛛(蛛纲目)如美洲花蛛、杂色花蛛、波斯锐缘蛛、具环牛蛛、*decoloratus* 牛蛛、微小牛蛛、紫红短须螨、苜蓿苔螨、森林革蛛、柞蚕叶螨北方亚种、桔芽瘿螨、*truncatum* 璃眼蛛、蓖子硬蛛、*rubicundus* 硬蛛、非洲钝缘蛛、耳残喙蛛、榆全爪螨、*Permanyssus gallinae*、柑桔锈螨、*Polyphagotarsonemus latus*、羊痒螨、*appendiculatus* 扇头蛛、*evertsi* 扇头蛛、疥螨、红叶螨、*kanzawai* 叶螨、太平洋叶螨、红叶螨、棉叶螨。

线虫纲,例如,根瘿线虫,如 *hapla* 根结线虫、*incognita* 根结线虫、*javanica* 根结线虫,囊形线虫,如 *Globodera rostochiensis*、*avenae* 异皮线虫、*glycinae* 异皮线虫、*Schatii* 异皮线虫、*trifolii* 异皮线虫,朽叶烟虫,如 *Belonolaimus longicaudatus*、*destructor* 双垫刃线虫、*dipsaci* 双垫刃线虫、*Helicotylenchus multicinctus*、*Longidorus elongatus*、*Similis* 内侵线虫、*Rotylenchus robustus*、*Trichodorus primitivus*、*Tylenchorhynchus claytoni*、*Tylenchorhynchus dubius*、*neglectus* 草地垫刃线虫、*penetrans* 草地垫刃线虫、*curvatus* 草地垫刃线虫、*goodeyi* 草地垫刃线虫。

活性化合物可直接施用或以由此制得的它们的制剂或应用形式来施用,如以可直接喷雾的溶液、粉末、悬液或分散液、乳液、油分散液、糊剂、粉剂、可分散组合物或颗粒的形式喷雾、雾化、粉尘化、分散或倾注。施用形式完全取决于应用目的;但无论如何应

尽可能保证本发明的活性化合物最精细地分散。

在即用施用制剂中活性化合物的浓度可在一大范围内变化。

一般，浓度为 0.0001 到 10%，优选 0.01 到 1%。

这些化合物还可成功地用于超低体积方法 (ULV) 中，其中可能施用含高于 95% (重量) 的活性化合物的制剂，甚至不加添加剂的活性化合物。

为了在户外条件下控制害虫，活性化合物的施用率为 0.1—2.0，优选 0.2—1.0 kg/ha。

为了制备可直接喷雾的溶液、乳液、糊剂或油分散液，可使用中等到高沸点的矿物油馏份，如煤油或柴油，还有煤焦油和源自植物或动物的油，脂肪、环状或芳香烃，如苯、甲苯、二甲苯、石蜡、四氯化萘、烷基化萘或它们的衍生物，甲醇、乙醇、丙醇、丁醇、氯仿、四氯化碳、环己醇、环己酮、氯苯、异佛尔酮，强极性溶剂，如二甲基甲酰胺、二甲基亚砷、N—甲基吡咯烷酮和水。

通过加水可从浓乳液、糊剂或可湿性粉末 (油分散液) 制得水性施用形式。为制备乳液、糊剂或油分散液，可通过润湿剂、冲稠剂、分散剂或乳化剂，将物质直接均化在水中，或溶解在油或溶剂中。但还可以制备由活性物质、润湿剂、冲稠剂、分散剂或乳化剂和可能的溶剂或油组成的浓缩物，它适于用水稀释。

适当的表面活性物质为木素磺酸的碱金属、碱土金属和铵盐，萘磺酸，苯酚磺酸，二丁基萘磺酸，烷基芳基磺酸盐、烷基硫酸盐，烷基磺酸盐，脂肪醇硫酸盐和脂肪酸及它们的碱金属和碱土金属盐，硫酸化脂肪醇甘醇醚的盐，磺酸化萘和萘衍生物与甲醛的缩合物，萘或萘磺酸与苯酚及中醛的缩合产物，聚氧乙烯辛基苯酚醚，乙氧基

化的异辛基苯酚，辛基苯酚，壬基苯酚，烷基苯酚聚甘醇醚，三丁基苯基聚甘醇醚，烷基芳基聚醚醇，异十三烷醇，脂肪醇环氧乙烷缩合物，乙氧基化蓖麻油，聚氧亚烷基烷基醚，乙氧基化的聚氧丙烯，月桂醇聚甘醇醚缩醛，山梨醇酯，木素—亚硫酸盐废液和甲基纤维素。

通过活性化合物与固体载体混合或一起研磨可制备粉末，可分散组合物和粉剂。

制剂一般含有 0.01—95% (重量)，优选 0.1—90% (重量) 的活性化合物。可使用纯度为 90% 到 100%，优选 95% 到 100% (按 NMR 谱测定) 的活性化合物。

制剂的实例有：

- I. 将 5 重量份的表 B 的化合物 No. 1 与 95 重量份研细的高岭土紧密混合。这样得到含 5% (重量) 活性化合物的粉剂。
- II. 将 30 重量份的表 B 的化合物 No. 2 与 92 重量份粉碎的硅胶和 8 重量份石蜡油 (已喷在硅胶的表面) 的混合物紧密混合。这样得到具有良好粘性的活性化合物制剂 (活性化合物含量 23wt%)。
- III. 将 10 重量份表 B 中化合物 No. 3 溶解在这样的混合物中：它由 90 重量份二甲苯，6 重量份 8—10mol 环氧乙烷与 1mol 油酸 N—单乙醇酰胺的加成物，2 重量份十二烷基苯磺酸的钙盐和 2 重量份 40mol 环氧乙烷与 1mol 蓖麻油的加成物组成 (活性化合物含量 9wt%)。
- IV. 将 20 重量份表 B 中化合物 No. 4 溶解在这样的混合物中，它由 60 重量份环己酮，30 重量份异丁醇，5 重量份 7mol 环氧乙烷与 1mol 异辛基苯酚的加成物和 5 重量份 40mol 环氧乙烷与 1mol 蓖麻油的

加成物组成 (活性化合物含量 16wt%)。

V. 将 80 重量份表 B 中的化合物 No. 5 与 3 重量份二异丁基萘— $\alpha$ —磺酸的钠盐、10 重量份来自亚硫酸盐废液的木素磺酸的钠盐及 7 重量份粉碎的硅胶充分混合, 将此混合物在一锤磨机中研磨 (活性化合物含量 80wt%)。

VI. 将 90 重量份表 B 中化合物 No. 6 与 10 重量份 N—甲基—2—吡咯烷酮混合, 这样得到的溶液适于以非常小的液滴形式施用 (活性化合物含量 90wt%)。

VII. 将 20 重量份表 B 中的化合物 No. 7 溶于下述混合物中: 它由 40 重量份环己酮、30 重量份异丁醇、20 重量份 7mol 环氧乙烷与 1mol 异辛基苯酚的加成物及 10 重量份 40mol 环氧乙烷与 1mol 蓖麻油的加成物组成。将此溶液倾入 100, 000 重量份水中, 并精细地分散。得到的水分散液含有 0.02% (重量) 的活性化合物。

VIII. 将 20 重量份表 B 中的活性化合物 No. 8 与 3 重量份二异丁基萘— $\alpha$ —磺酸钠、17 重量份来自亚硫酸盐废液的木素磺酸钠和 60 重量份粉碎的硅胶充分混合, 并将混合物在锤磨机中研磨。将此混合物仔细分散在 20000 重量份水中, 得到的喷雾液含有 0.1wt% 的活性化合物。

活性化合物与固态载体结合可制得颗粒, 如包衣的、浸制的和均一的颗粒。固态载体例如有矿物类, 如硅胶、硅酸、硅胶、硅酸盐、滑石、高岭土、美国活性白土、石灰石、石灰、白垩、bolec、黄土、粘土、白云石、硅藻土、硫酸钙和硫酸镁、氧化镁, 研碎的合成材料、肥料, 如硫酸铵、磷酸铵、硝酸铵、脲素, 及植物产品, 如谷物粉、树皮、木和坚果壳粉, 纤维素粉和其它固态载体。



如果需要，在施用（罐内混合）前片刻还可向活性化合物加入各种类型的油、除草剂、杀真菌剂、其它杀虫剂和杀菌剂。这些试剂可与本发明组合物以 1:10—10:1 的重量比混合。

## 应用实例

### 1. 杀真菌活性

下列试验可以表明通式 I 化合物的杀真菌作用：

在 70wt% 环己醇、20wt% Nekanil<sup>®</sup> LN (Lutensol<sup>®</sup> AP6, 基于乙氧化的烷基苯酚的润湿剂，具有乳化剂和分散剂作用) 和 10wt% Emulphor<sup>®</sup> EL (Emulan<sup>®</sup> EL, 基于乙氧基化脂肪醇珠乳化剂) 的混合物中，将活性化合物制成浓度为 20% 的乳液，然后用水稀释至所需浓度。

#### 1.A 禾白粉菌 tritici 变种 (小麦霉)

将 Fruhgold 品种的小麦苗用活性化合物的水悬液喷雾，直到湿度。24 小时后，用真菌禾白粉菌 tritici 变种 (小麦霉) 的孢子向此植物撒粉。22℃—24℃ 及 75—80% 空气温度下 7 天后，测定叶子的真菌侵染。

在此试验中，用 63ppm 的化合物 3, 7, 8, 9, 11, 12, 14, 18, 19, 23, 27, 32, 33, 35, 49, 50, 51, 53, 54, 55, 56, 57, 58 和 59 处理的植物，显示 15% 和更小的侵染，而未处理的植物叶子表面 65% 侵染。

#### 1.B 葡萄生单轴霉 (葡萄霜霉)

盆栽的 Muller—Thurgau 变种的葡萄树用活性化合物水悬液喷雾，直到湿透。在温室中 8 天后，用葡萄生单轴霉 (葡萄霜霉) 的

游动孢子悬液感染叶子。先将植物置于 24℃ 且水蒸气饱和的室中计 48 小时,然后在 20℃—30℃ 温室中 5 天,再于 24℃ 水蒸气饱和的室中放置 16 小时,然后测定侵染。

在此试验中,用 63ppm 的化合物 3, 7, 8, 9, 10, 11, 12, 14, 15, 16, 17, 18, 21, 22, 23, 24, 25, 26, 27, 33, 34, 35, 36, 37, 38, 39, 40, 41, 42, 23, 44 和 48 处理过的植物显于侵染为 15% 和更小,而未处理的植物叶子底面的 80% 被侵染。

#### 1. *C. Pyricularia oryzae* (保护作用)

Tai—Nong 67 变种稻苗的叶子用活性化合物的水乳液(干物质含量: 80% 活性化合物和 20% 乳化剂)喷雾,直到湿度。24 小时后用 *Pyricularia oryzae* 的孢子悬液接种。然后将植物存放在 22—24℃, 95—99% 相对空气湿度的气候室中。6 天后测定侵染的程度。

在此试验中,用 250ppm 的化合物 3, 7, 8, 10, 11, 12, 20, 21, 22, 23, 24, 25, 26, 27, 32, 33, 38, 48, 49, 50, 51, 52, 53, 54 和 55 处理过的植物,显示侵染为 15% 及更小;而未处理的植物的叶表面 70% 被侵染。

#### 2. 对动物害虫的作用

可以通过下列试验显示通式 I 化合物的杀昆虫作用:

将活性化合物制成:

a) 0.1% 的丙酮溶液, 或

b) 在 70wt% 环己酮、20wt% Nekanil LN (Lutensol<sup>®</sup> AP6, 基于乙氧基化烷基酚的润湿剂, 具有乳化剂和分散剂作用) 和 10wt% Emulphor<sup>®</sup> EL (Emulan<sup>®</sup> EL, 基于乙氧基化脂肪醇的乳化剂) 的混合物中的 10% 乳液,

并且,根据所需浓度在a)中用丙酮稀释,或在b)中用水稀释。

试验结果是测定了与未处理的对照试验相比仍产生80—100%的抑制或亡的最低浓度(活性限或最小浓度)。

#### 2. A 豆豉蛾(蚋), 触杀作用

用活性化合物的水性制剂处理严重侵染的矮菜豆(蚕豆)。

24小时后测定死亡率。

在此试验中,化合物9, 18, 24, 37, 42, 43和44显示活性限为至少400ppm。

#### 2. B *Nephotettix cincticeps* (绿稻蝉), 触杀作用

用活性化合物的水制剂处理圆形滤器, 然后放入5只成年蝉。

24小时后测定死亡率。

在此试验中, 化合物3, 16, 24, 32, 33, 36, 40, 42, 46, 50, 51, 55, 56, 58, 61和63显示活性限为至少0.4mg。

#### 2. C 斜纹夜蛾(埃及棉叶虫), 生长试验

五只生长期L3的毛虫(10—12mm), 它们在触杀试验中没有受到可确定的损害, 用事先已用活性化合物水制剂润湿的标准营养培养基培养(3.1升水, 80g琼脂, 137g brewer's 酵母, 515g玉米粉, 130g小麦胚和常规添加剂和维生素(20g wesson 盐, 5g Nipagin, 5g Sorbin, 10g纤维素, 18g抗坏血酸, 1g Lutavit<sup>R</sup> 混合物(维生素), 5ml生物素醇的溶液)。持续观察直到无活性化合物的对照组孵出蛾。

在此试验中, 化合物9, 24, 26, 40, 42, 43, 44, 51, 52和63显示活性限至少为0.4mg。

#### 2. D、蔷薇回爪螨(红蛛螨), 触杀作用

具有第二对成熟叶子的严重侵染的盆栽矮菜豆，用活性化合物的水制剂处理。

在温室中 5 天后，用双目显微镜测定控制的效果。

在此试验中，化合物 7, 8, 9, 18, 23, 24, 37, 40, 37, 40, 42, 23, 44, 49, 50, 51, 52, 61 和 63 显示活性限为至少 400ppm。